# **EUROPEAN PATENT OFFICE**

## Patent Abstracts of Japan

PUBLICATION NUMBER : 11322729  PUBLICATION DATE : 24-11-99  A-N H	BEST
APPLICATION DATE : 04-03-99 APPLICATION NUMBER : 11057378	AVAILA
APPLICANT: HOKURIKU SEIYAKU CO LTD;  INVENTOR: TOMITA YAYOI;	BLE C
INT.CL. : C07D263/20 C07D413/10 // A61K 31/00 A61K 31/42 A61K 31/42 A61K 31/44	пР

TITLE : DITHIOCARBAMIC ACID DERIVATIVE

A61K 31/535

A61K 31/44 A61K 31/445 A61K 31/495

A-N NHCS<sub>2</sub>

ABSTRACT: PROBLEM TO BE SOLVED: To obtain a new compound having excellent antimicrobial activities against various bacteria and fungi including multiple resistant microbe and atypical mycobacteria, and useful as an antibacterial or antifungal agent.

SOLUTION: This new compound is the one of formula I [R¹ is a (substituted) alkyl, a (substituted)cycloalkyl, a (substituted)aryl or the like; A is a (substituted) phenyl], e.g. methyl (S)-N-[2-oxo-3-[4-(thiomorpholin-4-yl)phenyl] oxazolin-5-yl]methyldithiocarbamate. The compound is obtained, for example, by using a compound of formula II as a raw material, reacting the compound of formula II with carbon disulfide in the presence of a base such as triethylamine in the absence of a solvent or in the solvent such as diethyl ether to provide a compound of formula III, and reacting the compound of formula III with an alkylation agent of the formula X-R¹ in the presence or absence of a base in the absence of the solvent or in the solvent within the temperature range from an ice-cooled temperature to 200°C.

COPYRIGHT: (C)1999,JPO

THIS PAGE BLANK (USPTO)

## 特開平11-322729

(43)公開日 平成11年(1999)11月24日

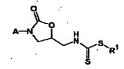
	(51) Int.Cl. <sup>6</sup>	識別記号		FΙ				
	C 0 7 D 263/20		•	C 0 7 D 2	63/20		• • .	
	413/10				13/10			
	// A 6 1 K 31/00	6 3 1		A61K	*	631C		
	31/42	601	······································		31/42	631G 601		
			審查請求		項の数 6 OL	· ·	最終頁に続く	
		特願平11-57378		(71) 出願人	000242622			
)					北陸製薬株式	<b>会社</b>		• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •
	(22)出顧日	平成11年(1999) 3月4日	•			猪野口37号 1:	<del>番</del> 曲 1	
	· -		·· <u>-</u>	(72)発明者				
	(31)優先権主張番号	特願平10-74982				猪野口37号1	番地1 北陸製	
	(32)優先日	平10(1998) 3月9日		-	菜株式会社内		· ·	
	(33)優先権主張国	日本 (JP)		(72)発明者	徳山 竜光	_		
	:	4			•	猪野口37号1	番地1 北陸製	
				<u> </u>	一菜株式会社内	·		
				(72)発明者	富田 弥生	·		
•	•	•		1	福井県勝山市	猪野口37号1	番地1 北陸製	
					<b>薬株式会社内</b>	·		
				1				

### (54) 【発明の名称】 ジチオカルバミド酸誘導体

### (57)【要約】

【課題】抗菌剤又は抗真菌剤として有用な化合物を提供する。

【解決手段】 次の一般式 【化1】



(式中、R<sup>1</sup>は置換されていてもよいアルキル基,置換されていてもよいシクロアルキル基,置換されていてもよいアリール基又は置換されていてもよいアラルキル基を表し、Aは置換されていてもよいフェニル基を表す。)で示されるジチオカルバミド酸誘導体又はその塩は、多剤耐性菌や非定型抗酸菌を含めた各種の細菌又は真菌に対して優れた抗菌作用を有し、抗菌剤又は抗真菌剤として極めて有用である。

医化氯化 化静态 建铁铁 達計 医抗视器的现在分词

【特許請求の範囲】 【請求項1】次の一般式

(化1)

Same and the same of the same

(式中、R1は置換されていてもよいアルキル基,置換されていてもよいシクロアルキル基,置換されていてもよいアリール基又は置換されていてもよいアラルキル基を表し、Aは置換されていてもよいフェニル基を表す。)で示されるジチオカルバミド酸誘導体又はその塩。

【請求項2】次の一般式 【化2】

(式中、R1は置換されていてもよいアルキル基,置換 されていてもよいシクロアルキル基、置換されていても よいアリール基又は置換されていてもよいアラルキル基 を表し、R2、R3及びR4は、各々独立して水素原子, ハロゲン原子、水酸基、メルカプト基、アミノ基、シア ノ基,ニトロ基,ホルミル基,カルボキシル基,カルバ モイル基、置換されていてもよいアルキル基、置換され ていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよい アルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置 換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよ いアルキルチオ基,置換されていてもよいアルコキシカ ルボニル基、置換されていてもよいアルキルアミノ基、 置換されていてもよいジアルキルアミノ基、置換されて いてもよいアルキルアミノカルボニル基、置換されてい てもよいジアルキルアミノカルボニル基,置換されてい てもよいアルカノイル基、置換されていてもよいアルカ ンスルホニル基、置換されていてもよいアリールカルボ ニル基、置換されていてもよいアリール基、置換されて いてもよいアラルキル基、置換されていてもよいアリー ルオキシ基、環構成原子としてヘテロ原子を含み置換さ れていてもよいシクロアルキルオキシ基、置換されてい てもよい飽和複素環基又は置換されていてもよいアリー ル基が縮合した飽和複素環基を表すか、あるいはR<sup>2</sup>, R³及びR⁴の任意の二つが一緒になってエチレンジオキ シ基を表すか、又はベンゼン環と共に置換されていても よい炭化水素縮合環を形成してもよい。)で示されるジー チオカルバミド酸誘導体又はその塩。

【請求項3】次の一般式

【化3】

(式中、R<sup>1</sup>は置換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよいアリール基又は置換されていてもよいアラルキル基を表し、R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、各々独立して水素原子、ハロゲン原子、水酸基、メルカプト基、アミノ基、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、カルボキシル基、面換されていてもよいアルキル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルケニル基、置換されていてもよいアルカノイル基を表す。)で示されるジチオカルバミド酸誘導体又はその塩。

【請求項4】請求項1から3のいずれか1項に記載の化 合物又はその塩を有効成分として含有する医薬。

【請求項5】抗菌剤である請求項1から3のいずれか1 項に記載の医薬。

【請求項6】抗真菌剤である請求項1から3のいずれか 1項に記載の医薬。

【発明の詳細な説明】

[0001]

【発明の属する技術分野】本発明は、医薬として、特に 抗菌剤又は抗真菌剤として有用な新規なジチオカルバミ 下酸誘導体又はその塩に関するものである。

[0002]

【従来の技術】本発明に類似する3-アリールー2-オ キソオキサゾリジン骨格を有する化合物としては、特開 昭60-8277号公報やジャーナル・オブ・メディシ ナル・ケミストリー (Journal of Medicinal Chemistr. v) . 39巻. 673頁(1996年)等に、N-[(3-アリール-2-オキソオキサゾリジン-5-イ ル)メチル] アセトアミド誘導体が、又、カレント・フ ァーマシューチカル・デザイン (Current Pharmaceutic al Design), 2巻, 175頁(1996年)やJournal of Medicinal Chemistry, 32巻, 1673頁(198 9年) 等に、3-アリール-5-ヒドロキシメチル-2 ーオキソオキサゾリジン誘導体や3ーアリールー5ーハ ロゲノメチルー2ーオキソオキサゾリジン誘導体等が開 示され、又、特開平9-316073号公報等には、N - (3-ヘテロアリール-2-オキソオキサゾリジン-5-イル) メチルチオアセトアミド誘導体やN-(3-ヘテロアリールー2ーオキソオキサゾリジンー5ーイ ル)メチル-N'-メチルチオ尿素誘導体等が開示さ れ、いずれもグラム陽性菌に対して抗菌活性を有する旨 記載されている。又、米国特許第4128654号に は、3-アリール-5-ハロゲノメチル-2-オキソオ キサゾリジン誘導体が植物のカビ性病害及び細菌性病害の防御に有用である旨記載されている。しかしながら、これらの化合物の抗菌活性は未だ十分とは言えず、より優れた抗菌剤又は抗真菌剤の開発が課題とされている。【0003】

【発明が解決しようとする課題】グラム陽性菌、グラム 陰性菌、嫌気性菌、真菌等をはじめとするさまざまな起 因菌による感染症の治療剤として、抗生物質や合成抗菌 剤等の作用メカニズムの異なる多種の抗菌剤が臨床に供 されている。しかし、近年これらの抗菌剤による化学療 法をより困難なものとしている原因の一つとして、メチ シリン耐性黄色ブドウ球菌 (MRSA; Methicillin-resist ant Staphylococcus aureus)等に代表される多剤耐性菌 による感染症が挙げられる。一方、基礎疾患を有しすで に化学療法を受けている患者、臓器移植に伴い免疫抑制 剤を投与されている患者、あるいはエイズ患者等のいわ ゆる易感染者においては、日和見感染症の増加が指摘さ れており、特に有効な抗菌剤に乏しい非定型抗酸菌症や 真菌症の化学療法が問題となってきている。非定型抗酸 菌症の中ではMycobacterium avium complex(Mycobacter ium avium, Mycobacterium intracellulare)を起因菌と する感染症や、真菌症の中ではカンジダ属 (Candida), クリプトコッカス属(Cryptococcus)、アスペルギルス 属(Aspergillus)等の酵母菌あるいは糸状菌を起因菌と

クリプトコッカス属(Cryptococcus),アスペルギルス 属(Aspergillus)等の酵母菌あるいは糸状菌を起因菌と する深在性真菌症の化学療法が特に深刻な問題となって きている。本発明は、多剤耐性菌や非定型抗酸菌を含め た各種の細菌又は真菌に対して優れた抗菌活性を有する 化合物を提供することを目的としている。

## [0004]

【課題を解決するための手段】本発明者らは上記の課題を解決すべく鋭意研究した結果、本発明に係る新規なジチオカルバミド酸誘導体又はその塩が、多剤耐性菌や非定型抗酸菌を含めた各種の細菌又は真菌に対して優れた抗菌活性を有する化合物であることを見出し、本発明を完成させた。

【0005】即ち、本発明は次の一般式(I) 【化4】

$$A-N \qquad H \qquad (1)$$

(式中、R<sup>1</sup>は置換されていてもよいアルキル基,置換されていてもよいシクロアルキル基,置換されていてもよいアリール基又は置換されていてもよいアラルキル基を表し、Aは置換されていてもよいフェニル基を表す。)で示される新規なジチオカルバミド酸誘導体又はその塩に関するものである。

【0006】本発明の好ましい態様によれば、次の一般式(II)

【化5】

(式中、R2, R3及びR4は、各々独立して水素原子、 ハロゲン原子、水酸基、メルカプト基、アミノ基、シア ノ基、ニトロ基、ホルミル基、カルボキシル基、カルバ モイル基、置換されていてもよいアルキル基、置換され ていてもよいシクロアルキル基、置換されていてもよい アルケニル基、置換されていてもよいアルキニル基、置 換されていてもよいアルコキシ基、置換されていてもよ いアルキルチオ基、置換されていてもよいアルコキシカ ルボニル基、置換されていてもよいアルキルアミノ基、 置換されていてもよいジアルキルアミノ基、置換されて いてもよいアルキルアミノカルボニル基,置換されてい てもよいジアルキルアミノカルボニル基、置換されてい でもよいアルカノイル基、置換されていてもよいアルカ ンスルホニル基、置換されていてもよいアリールカルボ ニル基、置換されていてもよいアリール基、置換されて いてもよいアラルキル基、置換されていてもよいアリー ルオキシ基、環構成原子としてヘテロ原子を含み置換さ れていてもよいシクロアルキルオキシ基、置換されてい てもよい飽和複素環基又は置換されていてもよいアリー ル基が縮合した飽和複素環基を表すか、あるいはR2 R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>の任意の二つが一緒になってエチレンジオキ シ基を表すか、又はベンゼン環と共に置換されていても よい炭化水素縮合環を形成してもよく、R1は前述と同 意義を表す。) で示される新規なジチオカルバミド酸誘 導体又はその塩が提供される。

【0007】又、本発明の更に好ましい態様によれば、 次の一般式(III) 【化6】

(式中、R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>は、各々独立して水素原子, ハロゲン原子, 水酸基, メルカプト基, アミノ基, シアノ基, ニトロ基, ホルミル基, カルボキシル基, カルバモイル基, 置換されていてもよいアルキル基, 置換されていてもよいアルカノロアルキル基, 置換されていてもよいアルカニル基, 置換されていてもよいアルコキシ基又は置換されていてもよいアルカノイル基を、R<sup>1</sup>は前述と同意義を表す。) で示される新規なジチオカルバミド酸誘導体又はその塩が提供される。

【0008】本発明の別の観点からは、本発明により、

上記のジチオカルバミド酸誘導体又はその塩を有効成分として含む医薬が提供される。本発明により提供される 医薬は、例えば、抗菌剤又は抗真菌剤として好適に用いることができる。 【0009】

【発明の実施の形態】本発明のジチオカルバミド酸誘導体の好ましい態様である前記一般式(II)及び(III)の化合物について、具体的に説明する。この化合物は、本発明の前記一般式(I)で示されるジチオカルバミド酸誘導体に包含され、前記一般式(I)中のAで示される基として、特定の置換フェニル基又は無置換フェニル基を有していることを特徴としている。もっとも、本発明の範囲は前記一般式(II)及び(III)の化合物に限定されることはなく、Aとして置換フェニル基又は無置換フェニル基を有する化合物は、いずれも本発明の範囲に包含されることはいうまでもない。

【0010】本発明の前記一般式(II)及び(III)において、R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>、R<sup>5</sup>、R<sup>6</sup>及びR<sup>7</sup>で示されるアルキル基としては、炭素数1~6個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基、例えば、メチル基、エチル基、n-プロピル基、イソプロピル基、n-ブチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、イソブチル基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、n-ペンチル基、イソブチル基、シクロアルキル基、クロアルキル基、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロアルキル基、例えば、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクログンチル基、シクロアルキル部分を含むアルキル基でという用語は、シクロアルキル部分を含むアルキル基(例えばシクロプロピルメチル基など)を包含する概念として用いる。)

【0011】本発明の前記一般式(II)において、 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>で示されるアリール基としては、 環構成原子として1~4個のヘテロ原子を含んでもよい 単環又は二環以上の環からなる芳香環を表し、例えば、 フェニル基, ピリジン-2-イル基, ピリジン-3-イ ル基, ピリジンー4ーイル基, ピラジンー2ーイル基, ピリミジン-2-イル基, ピリミジン-4-イル基, ピ リミジン-5-イル基, フラン-2-イル基, フラン-3-イル基,チオフェン-2-イル基,チオフェン-3 -イル基, ピロール-1-イル基, ピロール-2-イル 基、ピロールー3-イル基、ピラゾールー1-イル基、 ピラゾール-3-イル基、ピラゾール-4-イル基、ピ ラゾール-5-イル基、イミダゾール-1-イル基、イ ミダゾール-2-イル基、イミダゾール-4-イル基、 「イミダゾールー5-イル基,1H-1,2,3-トリア ゾールー1ーイル基, 1H-1, 2, 3-トリアゾール -4-イル基、1H-1、2、3-トリアゾール-5-イル基、1H-1、2、4-トリアゾールー1ーイル。 基, 1 H-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル基, 1 H-1, 2, 4-トリアゾール-5-イル基, テトラゾニ

ールー1-イル基,テトラゾール-5-イル基,オキサ ゾールー2-イル基、オキサゾールー4-イル基、オキ サゾールー5ーイル基、チアゾールー2ーイル基、チア <u>ゾール=4-イル基,チアゾール-5-イル基,ナフタ</u> レン-1-イル基, ナフタレン-2-イル基, ベンゾフ ラン-2-イル基, ベンゾフラン-3-イル基, ベンゾ フラン-4-イル基、ベンゾフラン-5-イル基、ベン ゾフラン-6-イル基, ベンゾフラン-7-イル基, ベ ンゾ [b] チオフェンー2-イル基, ベンゾ [b] チオ フェンー3ーイル基, ベンゾ [b] チオフェンー4ーイ ル基, ベンゾ [b] チオフェン-5-イル基, ベンゾ [b] チオフェン-6-イル基, ベンゾ [b] チオフェ ン-7-イル基、インドール-1-イル基、インドール -2-イル基、インドール-3-イル基、インドール-4-イル基、インドールー5-イル基、インドールー6 -イル基、インドール-7-イル基、ベンゾイミダゾー ルー1-イル基, ベンゾイミダゾールー2-イル基, ベ ンゾイミダゾールー4ーイル基ニベンゾイミダゾールー 5-イル基、ベンゾイミダゾール-6-イル基、ベンゾ イミダゾール-7-イル基, ベンゾトリアゾール-1-イル基, ベンゾトリアゾールー4ーイル基, ベンゾトリ アゾールー5-イル基、ベンゾトリアゾールー6-イル 基、ベンゾトリアゾールー7-イル基、ベンゾオキサゾ ールー2-イル基, ベンゾオキサゾールー4-イル基. ベンゾオキサゾール-5-イル基, ベンゾオキサゾール -6-イル基、ベンゾオキサゾール-7-イル基、ベン ゾチアゾール-2-イル基, ベンゾチアゾール-4-イ ル基、ベンゾチアゾールー5ーイル基、ベンゾチアゾー ルー6ーイル基、ベンゾチアゾールー7ーイル基等を挙 げることができ、アラルキル基は前述のアリール基が任 意の位置で置換した炭素数1~4個のアルキル基を表 し、例えば、ベンジル基、フェネチル基、フェニルプロ ピル基、フェニルブチル基、(ピリジン-2-イル)メ チル基, (ピラジン-2-イル)メチル基, (ピリミジ ン-2-イル) メチル基, フルフリル基, テニル基, (ピロール-1-イル)メチル基、(ピラゾール-1-イル)メチル基、(イミダゾール-1-イル)メチル 基, (1H-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル)メ チル基, (1H-1, 2, 4-トリアゾールー1-イ ル)メチル基、(テトラゾール-5-イル)メチル基、 (オキサゾール-2-イル) メチル基, (チアゾール-2-イル) メチル基、(ナフタレン-1-イル) メチル 基、(ベンゾフラン-2-イル)メチル基、(ベンゾ [b] チオフェン-2-イル) メチル基,(インドール。 -1-イル) メチル基,(ベンゾイミダゾール-1-イ ル)メチル基、(ベンゾトリアゾールー1-イル)メチ ル基, (ベンゾオキサゾール-2-イル)メチル基, (ベンゾチアゾールー2ーイル) メチル基等を挙げるこ とができる。

【0012】本発明の前記一般式(II)及び(III)に

おいて、R2, R3, R4, R5, R6及びR7で示されるハーブチルーNーメチルアミノ基、N-tert-ブチルーN-ロゲン原子としては、フッ素原子, 塩素原子, 臭素原 子、ヨウ素原子が、アルケニル基としては、炭素数2~ 4個のアルケニル基、例えば、ビニル基、プロペニル 基、ブテニル基、ブタジエニル基等を挙げることがで き、アルキニル基としては、炭素数2~4個のアルキニ ル基、例えば、エチニル基、プロピニル基、ブチニル基 等を挙げることができ、又、アルコキシ基としては、炭 素数1~6個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基を含有 するアルコキシ基、例えば、メトキシ基、エトキシ基、 n-プロポキシ基, イソプロポキシ基, n-ブトキシ基, イ ソブトキシ基, sec-ブトキシ基, tert-ブトキシ基, n-ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基、ネオペンチ ルオキシ基, n-ヘキシルオキシ基等を挙げることがで き、アルカノイル基としては、例えば、アセチル基、プ ロピオニル基、ブチリル基、イソブチリル基、バレリル 基、イソバレリル基、ヘキサノイル基、ヘプタノイル基-等を挙げることができる

【0013】本発明の前記一般式(II)において、 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>で示されるアルキルチオ基としては、 炭素数1~6個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基を含 有するアルキルチオ基、例えば、メチルチオ基、エチル チオ基, n-プロピルチオ基, イソプロピルチオ基, n-ブ チルチオ基, イソブチルチオ基, sec-ブチルチオ基, te rt-ブチルチオ基、n-ペンチルチオ基、イソペンチルチ オ基, ネオペンチルチオ基, n-ヘキシルチオ基等を挙げ ることができ、アルコキシカルボニル基としては、炭素 数1~6個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基を含有す るアルコキシカルボニル基、例えば、メトキシカルボニ ル基、エトキシカルボニル基、n-プロポキシカルボニル 基, イソプロポキシカルボニル基, n-ブトキシカルボニ ル基, イソブトキシカルボニル基, sec-ブトキシカルボ ニル基, tert-ブトキシカルボニル基, n-ペンチルオキ シカルボニル基、イソペンチルオキシカルボニル基、ネ オペンチルオキシカルボニル基、n-ヘキシルオキシカル ボニル基等を挙げることができる。

メチルアミノ基、NーメチルーNーnーペンチルアミノ 基,N-イソペンチル-N-メチルアミノ基,N-メチ ルーNーネオペンチルアミノ基、N-n-ヘキシルーN-メチルアミノ基、シクロプロピルアミノ基、シクロブチ ルアミノ基、シクロペンチルアミノ基、シクロヘキシル アミノ基, N-シクロプロピル-N-メチルアミノ基, N-シクロブチル-N-メチルアミノ基, N-シクロペ ンチルーNーメチルアミノ基, Nーシクロヘキシルメチ ルーN-メチルアミノ基等を挙げることができる。 【0015】又、本発明の前記一般式(II)において、 R2, R3及びR4で示されるアルキルアミノカルボニル 基又はジアルキルアミノカルボニル基は、炭素数1~6 個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基、あるいは炭素数 3~6個のシクロアルキル基で置換されたアミノカルボ ニル基を表し、例えば、メチルアミノカルボニル基、エ ーチルアミノカルボニル基, n-プロピルアミノカルボニル 基、イソプロピルアミノカルボニル基、n-ブチルアミノ - カルボニル基, イソブチルアミノカルボニル基, sec-ブ チルアミノカルボニル基, tert-ブチルアミノカルボニ ル基, n-ペンチルアミノカルボニル基, イソペンチルア ミノカルボニル基、ネオペンチルアミノカルボニル基、 n-ヘキシルアミノカルボニル基, ジメチルアミノカルボ ニル基,ジエチルアミノカルボニル基, N-エチルーN ーメチルアミノカルボニル基、NーメチルーN-n-プロ ピルアミフカルボニル基、NーイソプロピルーNーメチ ルアミノカルボニル基, N-n-ブチル-N-メチルアミ ノカルボニル基、N-イソブチル-N-メチルアミノカ ルボニル基, N-sec-ブチル-N-メチルアミノカルボ ニル基, N-tert-ブチル-N-メチルアミノカルボニ ル基, N-メチル-N-n-ペンチルアミノカルボニル 基、N-イソペンチル-N-メチルアミノカルボニル 基、N-メチル-N-ネオペンチルアミノカルボニル 基, N-n-ヘキシル-N-メチルアミノカルボニル基, シクロプロピルアミノガルポニル基、シクロブチルアミ ノカルボニル基、シクロペンチルアミノカルボニル基、 シクロヘキシルアミノカルボニル基、N-シクロプロピ ルーNーメチルアミノカルボニル基、Nーシクロブチル -N-メチルアミノカルボニル基, N-シクロペンチル -N-メチルアミノカルボニル基, N-シクロヘキシル メチルーN-メチルアミノカルボニル基等を挙げること ができる。

【0016】本発明の前記一般式(II)において、R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>で示されるアルカンスルホニル基は、炭素数1~6個の直鎖状又は分枝鎖状のアルキル基で置換されたスルホニル基を表し、例えば、メタンスルホニル基, エタンスルホニル基, n-プロパンスルホニル基, n-ブタンスルホニル基, n-ベキサンスルホニル等を挙げることができる。又、アリールカルボニル基は、前記のアリール基にカルボニル基

(ピロール-1-イル) カルボニル基, (ピラゾールー 1-イル) カルボニル基、(イミダゾール-1-イル) カルボニル基、(1H-1、2、3-トリアゾール-1 -イル) カルボニル基、(1H-1,2,4-トリアゾ ール-1-イル) カルボニル基, (テトラゾール-5-イル) カルボニル基、(オキサゾールー2ーイル) カル ボニル基、(チアゾール-2-イル)カルボニル基, (ナフタレン-1-イル) カルボニル基、(ベンゾフラ ン-2-イル) カルボニル基, (ベンゾ [b] チオフェ ンー2ーイル) カルボニル基、(インドールー1) イー フレ) カルボニル基, (ベンゾイミダゾールー1ーイフレ)\_ カルボニル基、 (ベンゾトリアゾール-1-イル) カル ボニル基, (ベンゾオキサゾール-2-イル) カルボニ ル基、(ベンゾチアゾールー2-イル)カルボニル基等。 を挙げることができ、アリールオキシ基としては、例え ば、フェノキシ基、(ピリジン-2-イル)オキシ基、 (ピラジン-2-イル) オキシ基、(ピリミジン-2-イル) オキシ基, (フラン-2-イル) オキシ基, (チ オフェン-2-イル) オキシ基, (ピロール-2-イ ル) オキシ基,(ピラゾール-5-イル) オキシ基, (イミダゾールー5-イル) オキシ基, (1H-1, 2-3-トリアゾール-5-イル) オキシ基, (1H= 1, 2, 4-トリアゾールー5-イル) オキシ基, (テ トラゾールー5ーイル) オキシ基,(オキサゾールー2 ーイル) オキシ基、 (チアゾールー2ーイル) オキシ 基、(ナフタレン-1-イル)オキシ基、(ベンゾフラ ン-2-イル) オキシ基, (ベンゾ [b] チオフェン-2-イル) オキシ基、(インドール-4-イル) オキシ 基,(ベンゾイミダゾールー4-イル)オキシ基,(ベ ンゾトリアゾール-4-イル) オキシ基, (ベンゾオキ サゾール-2-イル) オキシ基、(ベンゾチアゾール-2-イル) オキシ基等を挙げることができる。 【0017】本発明の前記一般式(II)において、 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>で示される環構成原子としてヘテロ原 子を含むシクロアルキルオキシ基としては、例えば、ア ゼチジニルオキシ基,ピロリジニルオキシ基,ピペリジ ルオキシ基、ホモピペリジルオキシ基、オキセタニルオ キシ基、テトラヒドロフラニルオキシ基、テトラヒドロ ピラニルオキシ基,チエタニルオキシ基,テトラヒドロ チオフェニルオキシ基、テトラヒドロチオピラニルオキ ・シ基、オキサゾリジニルオキシ基、チアゾリジニルオキ シ基、ピペラジニルオキシ基、モルホリニルオキシ基、 チオモルホリニルオキシ基、1-オキシドチオモルホリ ニーニルオキシ基、1、1ージオキシドチオモルホリニルオ キシ基、ホモピペラジニルオキシ基、3-アザビシクロ [3.3.0]オクタニルオキシ基、3、7ージアザビ

ン-2-イル) カルボニル基。(ピラジン-2-イル)

カルボニル基,(ピリミジンー2ーイル)カルボニル

基、(フラン-2-イル)カルボニル基、テノイル基、

○○ が置換した基を表し、例えば、ベンゾイル基 (同りジャッ分をシクロ[3.3.0]オクタニルオキシ基等を挙げるこ とができ、飽和複素環基としては、例えば、アゼチジニ ル基、ピロリジニル基、オキサソリジニル基、チアソリ ジニル基、ピペリジル基、ピペラジニル基、オキセタニ ル基、テトラヒドロフラニル基、テトラヒドロピラニル 基、チエタニル基、テトラヒドロチオフェニル基、テト ラヒドロチオピラニル基、モルホリニル基、チオモルホ リニル基, 1-オキシドチオモルホリニル基, 1, 1-ジオキシドチオモルホリニル基。ホモピペリジル基。ホ モピペラジニル基,3ーアザビシクロ [3.3.0]オ クタニル基, 3, 7-ジアザビシクロ[3.3.0]オ クタニル基等を挙げることができ、又、アリール基を縮 合した飽和複素環基としては、例えば、インドリニル 基、イソインドリニル基、1、2、3、4ーテトラヒド ロイソキノリル基、2、3-ジヒドロ-1H-ピロロ [3,4-b] ピリジン-2-イル基,2,3-ジヒド ロー1H-ピロロ[3,4-c]ピリジン-2-イル基 等を挙げることができる。

【0018】又、本発明の前記一般式(II)において、 R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>及びR<sup>4</sup>の任意の二つが一緒になってベンゼン 環と共に炭化水素縮合環を形成する場合の縮合環基とし ては、例えば、インダン-5-イル基、1-インダノン -5-イル基, インデン-5-イル基, インデン-6-イル基, 1-インダノン-6-イル基, 2-インダノン -5-イル基、1、3-インダンジオン-5-イル基、 ナフタレンー2ーイル基、1 (2H) ーナフタレノン-6-イル基, 1(2H)-ナフタレノン-7-イル基, 1, 2, 3, 4ーテトラヒドロナフタレンー6ーイル 基, 1, 2, 3, 4ーテトラヒドロー1ーナフタレノン -6-イル基, 1, 2, 3, 4-テトラヒドロー1-ナ フタレノン-7-イル基, 1, 2, 3, 4-テトラヒド ロー2-ナフタレノン-6-イル基,1,2,3,4-テトラヒドロー2ーナフタレノン-7-イル基、1、2 ーナフトキノンー6ーイル基、1、2ーナフトキノンー 7-イル基、1、4-ナフトキノン-6-イル基、フル オレン-2-イル基, フルオレン-3-イル基, フルオ レノン-2-イル基, フルオレノン-3-イル基, アン トラセン-1-イル基, アントラセン-2-イル基等を 挙げることができる。

【0019】本発明の前記一般式(II)において、ある 官能基について「置換されていてもよい」という場合に は、その置換基の個数及び種類は特に限定されず、2個 以上の置換基が存在する場合には、それらは同一でも異 なっていてもよい。このような置換基としては、例え ば、アルキル基、シクロアルキル基、水酸基、メルカプ ト基、アルコキシ基、アルキルチオ基、ハロゲン原子、 アミノ基、アルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基、シ アノ基、ニトロ基、ホルミル基、アルコキシカルボニル 基、アルコキシアルキル基、アルコキシカルボニルアル キル基、カルボキシアルキル基、ヒドロキシアルカノイ

ル基、アルコキシアルコキシ基、アルコキシアルカノイル基、ベンジルオキシカルボニル基、ベンジルオキシアルカノイル基、アルキルアミノアルコキシ基、ジアルキルアミノアルキルチュールアミノアルキル基、ジアルキルアミノアルキル基、アルキルアミノアルキル基、オキソ基、ヒドロキシイミノ基、アルコキシイミノ基、カルボキシル基、アルカノイルアルキル基、カルバモイル基、アリール基、アラルキル基、アルコキシカルボニルアミノアルキル基、アルカンスルホニルアミノアルキル基等を挙げることができる。

【0020】本発明の前記一般式(III)において、ある官能基について「置換されていてもよい」という場合には、その置換基の個数及び種類は特に限定されず、2個以上の置換基が存在する場合には、それらは同一でも異なっていてもよい。このような置換基としては、例えば、アルキル基、シクロアルキル基、水酸基、メルカプト基、アルコキシ基、アルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、アルコキシ基、デルキルチオ基、ハロゲン原子、アミノ基、アルキルアミノ基、ジアルキルアミノ基、シアノ基、ニトロ基、ホルミル基、オキソ基、ヒドロキシイミノ基、アルコキシイミノ基、アリールオキシイミノ基、カルボキシル基、アルカノイル基、カルバモイル基等を挙げることができる。

【0021】本発明のジチオカルバミド酸誘導体は、オーキサブサジン環内に1個の不斉炭素を有しており、置換基の種類に応じて更に1個以上の不斉炭素を有する場合がある。本発明化合物に存在する不斉炭素は、それぞれ独立に(R)又は(S)配置を取ることができ、1個以上の不斉炭素に基づく光学異性体やジアステレオ異性体などの立体異性体が存在する場合がある。純粋な形態の立体異性体、立体異性体の任意の混合物、ラセミ体などはいずれも本発明の範囲に包含される。

【0022】本発明のジチオカルバミド酸誘導体は、所

望により塩、好ましくは薬理学的に許容しうる塩に変換 することができ、又、生成した塩から遊離形態の化合物 に変換することもできる。本発明の化合物の塩として は、酸付加塩又はアルカリ付加塩が挙げられ、酸付加塩 としては、例えば、塩酸塩、臭化水素酸塩、硝酸塩、硫 酸塩、ヨウ化水素酸塩もしくは燐酸塩等の鉱酸塩、又 は、酢酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、クエン酸塩、 シュウ酸塩, リンゴ酸塩, メタンスルホン酸塩, p-トル エンスルホン酸塩、マンデル酸塩、10-カンファース ルホン酸塩、酒石酸塩、乳酸塩、5-オキソテトラヒド ロフラン-2-カルボン酸塩もしくは2-ヒドロキシグ ルタル酸塩等の有機酸塩を用いることができる。又、ア ルカリ付加塩としては、例えば、ナトリウム塩、カリウ ム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩もしくはアンモニ ウム塩等の無機アルカリ塩、又は、エタノールアミン 塩、N、Nージアルキルエタノールアミン塩、トリエタ ノールアミン塩、ピペリジン塩、ピペラジン塩、モルホ リン塩もしくはチオモルホリン塩等の有機塩基の塩を用 いることができる。

【0023】本発明のジチオカルバミド酸誘導体又はその塩は、製造条件により任意の結晶形として存在することができ、又、任意の水和物又は溶媒和物として存在することもできるが、これらの結晶形、水和物及び溶媒和物並びにそれらの混合物も本発明の範囲に包含される。【0024】本発明の好ましい化合物としては以下の様な化合物を挙げることができるが、本発明はこれらの例に限定されるものではない。尚、表中の略語は次の意味を表す。Me:メチル基、Et:エチル基、n-Pr:n-プロピル基、i-Pr:イソプロピル基、n-Bu:n-ブチル基、i-Bu:イソブチル基、tert-Bu:tert-ブチル基、n-Pent:nーペンチル基、n-Hex:n-ヘキシル基、Ph:フェニル基、Bn:ベンジル基。

[0025]

【表1】

					· · · ·
	No.	A	No.	A	1
	1	<b>\_</b>	2	<u></u>	
	3	Mo-C	4	Me———	
	5	Et-	6.	Et—	
	7	n-Pr	8	n-Pr	
	9	LP7-	10	HY - S	
	11	n-Bu—	12	n-Bu————————————————————————————————————	
	13	i-Bu	14	I-Bu————————————————————————————————————	
	15	n-Pent—	16	n-Pent———	
	17	n-Hex—	18	n-Hex—	
	19	MeO-	20	MeO — F	*
-	21	EtO-	22	EtO-	
	23	n-PrO-	24	n-PrO-	
	25	i-Pro-	26	LPro-	÷ .
					•

[0026]

【表2】

Ŏ.	9 ' '	 •	
$\mathcal{L}_{0}$			
A-N 1 !!		0	
	<u>_S</u>	 	
<u> </u>	Me		
. S	•		

	<u> </u>		3
No.	Α	. No.	A
27	n-BuO—	28	n-BuO————
29	n-PentO	30	n-Pento—
31	n-HexO-	32	n-HexO—
33	Me	34	Me
35	Me	36	F—()—
37	c-	38	F <sub>3</sub> C-
39	F—————————————————————————————————————	<b>—40</b>	
41	<b>*</b>	42	Me —
43	Me F	44	\$
·· 45	Et F	46	n-PT
47	n-Pr	48	, S
49	LPr F	50	n-Bu
51	n-Bu F	52 ( == 0	EtO <sub>2</sub> C-

[0027]

【表3】

			S Me
No.	Α	No.	Α
53	EtO <sub>2</sub> C—	54	H <sub>2</sub> N
55	H <sub>2</sub> N F	56	MeHN
57	MoHN F	58	Me <sub>2</sub> N
59	Me <sub>2</sub> N	60	MeO~~0~
61	Me0 0 5	62	Me <sub>2</sub> N 0
63	Me <sub>z</sub> N C	64	Me <sub>2</sub> N O
65	Me <sub>2</sub> N O	66	Me <sub>2</sub> N O
67	Me <sub>2</sub> N F	68	H <sub>2</sub> N—
69	H <sub>2</sub> N—	70	MeHN—
71	МеНN————————————————————————————————————	72	Me <sub>2</sub> N-
73	Ma <sub>2</sub> N—	74	Me Et
75	Me N Et	76	Et <sub>2</sub> N-
77	Et <sub>2</sub> N—	78	

[0028]

【表4】

			Me S
No.	A	No.	A
79	\\\-\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	80	<b>○-</b>
81	N-S-	82	
83		84	
85		86	
87	\$\_\	88	\$\\\-\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
89		90	s
91	o=sN	92	0=\$\_N-\\
93	;;( <u>)</u> -( <u>)</u> -	94	
95	ни_и{_}-	96	HN N-
97	Mo-\_N-\	98	Me————————————————————————————————————
99	Et-\_N-\	100	

[0029]

【表5】

,,	4 4	1.1	٠.	
_A-N_	)			
			S,	
	<del></del>	-∏- S		Me-

•			S
No.	A	No.	A
101	n-Py —	102	n-Pr-\\N-\\F
103	n-Bu-CN-CN-	104	n-Bu—\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
105	Ph-\_N-\_\_\	106	Ph—\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\
107	Bn-\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	108	Bn—\\\\
109	Me-N_N-{_}	110	Me-N N-S-
111	Et-N_N-{_}	112	Et-N N-
113	n-Pr-N N-	114	n-Pr-N_N-\_N-\_F
115	I-Pr-N N-(_)-	116	1-Pr-N_N
117	n-Bu-N N-	118	n-Bu-N N-
119	MeO <sub>2</sub> c-N_N-	120	MeO <sub>2</sub> C-N N-
121	EtO <sub>2</sub> C-N N-	122	EKO <sub>2</sub> C-N N-
123	MeQ_N_N_N_	124	MeO N-S-
125	MeO N N N	126	MeO N-
127	MeO <sub>2</sub> C N N—	128	MeO <sub>2</sub> C N N F

[0030]

J.	· ·
A-N	H N S
	S Me

	<u> </u>	<u> </u>	S
No.	A	No.	A
129	EKO <sub>2</sub> C N N—	130	EIO2C N N-
_131	MeO <sub>2</sub> C	132	MeO <sub>2</sub> C N N-
133	EtO <sub>2</sub> C N N — N — N — N — N — N — N — N — N —	134	EtO <sub>2</sub> C N N-
135	MeO <sub>2</sub> C N N	136	MoO <sub>2</sub> C N N
137	EKO2C~~NN=	∵138	EKO <sub>2</sub> C N N N
139	MeO <sub>2</sub> C N N	140	MeO <sub>2</sub> C N N N
141	EFO <sub>2</sub> C	142	_EtO <sub>2</sub> C
143		144	
145	\\	146	\_\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\
147	<b>√</b> ~- <b>√</b>	148	N
149		150	
151		152	

[0031]

【表7】

ارگر	,	
A-N H	<u>.</u> .عـ	
	s	Me-

			3
No.	Α	No.	Α
153	Me-N	154	Me-N
155		156	E1-N -0-
157	n-Pr-N	158	n-Pr -N -0 -
159	n-Bu-N -0-	160	n-Bu-N -0-
161	MeO <sub>2</sub> C-N O-	162	MeO <sub>2</sub> C-N O-
163	EKO <sub>2</sub> C-N O-	164	EKO2C-N -O-
165	HOOO	166	HO_LO_O_
167	но~ по	168	но
169	Meo No-o-	170	MeO NO O
171	MeO N N O - O - O	172	MeO N O F
173	EtO <sub>2</sub> C^N0-{_}	174	EtO <sub>2</sub> C N O
175	Et0 <sub>2</sub> C \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	176	Exo2c N O-O-S
177	ENO <sub>2</sub> C ~ N _ O - C_	178	EtO <sub>2</sub> C N O

[0032]

【表8】

No.       A       No.       A         179       Me-NQ-O       180       Me-NQ-O         181       MeO <sub>2</sub> C-NQ-O       182       MeO <sub>2</sub> C-NQ-O         183       MeO       184       MeO <sub>2</sub> C-NQ-O         185       ERO <sub>2</sub> C-NQ-O       186       ERO <sub>2</sub> C-NQ-O         187       HO       188       HO         189       HS       190       HS         191       MeS       192       MeS         193       NC       194       NC         195       O <sub>2</sub> N       196       O <sub>2</sub> N         197       HO       198       HO         199       O <sub>2</sub> N       P         201       O <sub>2</sub> N       P         202       P         203       H <sub>2</sub> C=CH       204       H <sub>2</sub> C=CH         205       HC=CH       206       HC=CH			, <b>S</b>	
181 MeO <sub>2</sub> G-N O 182 MeO <sub>2</sub> C-N O 183 MeO 184 MeO 185 O 185 MeO <sub>2</sub> C-N O 186 Meo 187 Meo 188 Meo	No.	Α	No.	A
183	179	Ma-N\\ -0-\(\)	180	Me−N
185 Ero2c	181	MeO <sub>2</sub> G-N\rightarrow-0-\limits\rightarrow-	182	MeO₂C−N O−O−F
185  187  HO  188  HO  188  HO  189  HS  190  HS  191  MeS  192  MeS  194  NC  195  0 <sub>2</sub> N  196  197  198  HO  199  200  F  201  202  H <sub>2</sub> C=CH  204  H <sub>2</sub> C=CH	183		184	Meo N 0 - 0
189  HS  190  HS  191  MeS  192  MeS  193  NC  194  NC  195  0 <sub>2</sub> N  196  197  198  HO  198  HO  198  HO  198  HO  199  200  P  201  202  P  203  H <sub>2</sub> C=CH  204  H <sub>2</sub> C=CH	185	E10-2C	186	EIO-C~N\\-0-\\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\-\
191 MeS— 192 MeS— 193 NC— 194 NC— 195 O <sub>2</sub> N— 196 O <sub>2</sub> N— 196 I98 HO F  199 — 200 — 199 — 201 — 202 — 196 Incomplete the second of	187	но-	188	но—
191 Mes— 192  193 NC— 194 NC— 195  195 O <sub>2</sub> N— 196 O <sub>2</sub> N— 198  199	189	нѕ—	190	HS———
195 O <sub>2</sub> N 196 O <sub>2</sub> N 197 198 199 199 200 F  201	191	MeS-	192	MoS———
195 O <sub>2</sub> N 196  197 198 HO  199 200 F  201	193	NC-	194	NC
197 HO  198 HO  199  200  201  202  H <sub>2</sub> C=CH-  204  H <sub>2</sub> C=CH-  F	195	0 <sub>2</sub> N-{}	196	<b>}=</b> /
201	197	но	198	
203 H <sub>2</sub> C=CH- 204 H <sub>2</sub> C=CH- F	199	$\bigcirc$ — $\bigcirc$ —	200	
203	201	<b>○-○</b> -	202	
205 HC≡CH— 206 HC≡CH— F	203	н₂с==сн-{_}	204	н₂с≔сн— <b>∕</b>
	205	нс=сн-{_}	206	нс=сн-

[0033]

【表9】

	%,	I		
A=N	\\	<b>₩</b>	✓S.	
<del>`</del>			S	Me_

				S
	No.	Α	No.	Α .
	207	MeO <sub>2</sub> S-	208	MeO <sub>2</sub> S
1	209		210	
-	211		212	
	213		214	
	215		216	
	217		218	
	219		220	MeO — MeO
_	221	MeO MeO	222	Me
	223	Me————————————————————————————————————	224	MeO —
	225	N-S	226	N—————————————————————————————————————
	227	Me Me	228	o n-Pr−O
	229	MeO — N— MeO		
		NICO	ш	<u> </u>

[0034]

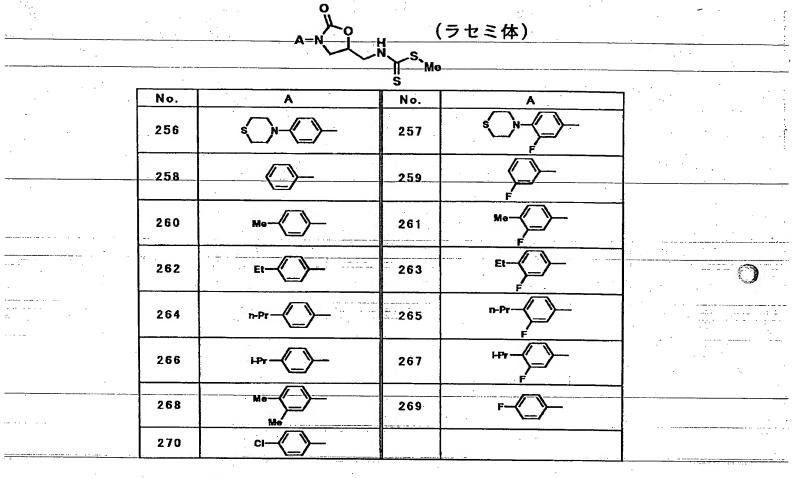
【表10】

	O O
	Lo
- S N-(-)	
	S R1
۲	" " " " " " " " " " " " " " " " " " "

No.	R¹	No.	R'
230	Et	231	n-Pr
232	i-Pr	233	n-Bu
234	i-Bu	235	tert-Bu
236	n-Pent	237	n-Hex
238	$\neg$	239	$\nearrow$
240	$\rightarrow$	241	— <b></b>
242		243	-
244	{}	245	——————————————————————————————————————
246	<b>—</b> Сі	247	<b>-</b> ₹
248		249	_( <sub>2</sub> )
250		251	
252	∕—Mo	253	OMe
254	~CI	255	

[0035]

【表11】



【0036】本発明の前記一般式(I)で示されるジチオカルバミド酸誘導体は、例えば、以下に記載する方法により製造することができるが、当該化合物の製造方法はこれらの方法に限定されるわけではない。尚、下記の製造方法では、前記一般式(I)で示される化合物について具体的に説明するが、これらの製造方法中に前記一般式(II)及び(III)で示される化合物が包含されていることは自明である。更に、本明細書の実施例には、本発明のジチオカルバミド酸誘導体の代表的化合物についての、具体的かつ詳細な製造方法が説明されている。

従って、下記の一般的説明及び実施例の具体的説明を参照しつつ、原料化合物、反応試薬及び反応条件などを適宜選択し、必要に応じてこれらの方法に適切な修飾ないしは改変を加えることによって、当業者は、前記一般式(I)に包含される本発明の化合物をいずれも容易に製造可能である。

【0037】本発明化合物は、例えば、以下の方法で製造することができる。

【化7】

(式中、R<sup>1</sup>及びAは前述と同意義を表し、Xはハロゲン原子、メタンスルホニルオキシ基又はアトルエンスルホニルオキシ基を表す。)即ち、本発明化合物の製造方法として、一般式(IV)で示される化合物を原料として、塩基の存在下、無溶媒あるいは溶媒中二硫化炭素を反応させ、一般式(V)で示される化合物となし、更に化合物(V)に一般式(VI)で示されるアルキル化剤

を、塩基の存在下あるいは非存在下、無溶媒あるいは溶媒中で反応させることにより製造することができる。 【0038】本製造方法において使用される塩基としては、例えば、トリエチルアミン、N、Nージイソプロピルエチルアミン、4ージメチルアミノピリジン、1、8ージアザビシクロ[5.4.0]-7ーウンデセン、

1, 2, 2, 6, 6-ペンタメチルピペリジン等の有機

塩基、あるいは水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸水素カリウム、水素化ナトリウム等の無機塩基が挙げられる。使用される溶媒は、それ自体反応において不活性であって、かつ反応を阻害しないものであればいかなるものでもよく、例えば、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、テトラヒドロフラン等のエーテル系溶媒、アセトン、アセトニトリル、N、Nージメチルホルムアミド、Nーメチルー2ーピロリドン、ジメチルスルホキシド、テトラメチレンスルホン、テトラメチレンスルホキシド、ヘキサメチルホスフォリックトリアミド等の非プロトン性極性溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等のエステル系溶媒、ベンゼン、トルエン等の芳香族炭化水素系溶媒、ピリジン、ピコリン、ルチジン、コリジン等

-73455号公報やJournal of Medicinal Chemistry,39巻,673頁及び680頁(1996年)等に製造方法等が既に開示されている公知化合物である。尚、一部新規な化合物については、例えば、以下の方法で製造することができ、その製造方法の詳細については

・参考例に記載した。 【化8】

(式中、Aは前述と同意義を、Bocはtert-ブトキシカル ボニル基を、Zはベンジルオキシカルボニル基を、Msは メタンスルホニル基を、Phはフェニル基を表す。)

【0040】工程1においては、一般式 (VII) の化合物を適当な還元方法、例えば、酸化白金, ラネーニッケル, パラジウム炭素等の触媒を用いた水素化還元法、鉄粉と塩酸, 酢酸等を用いた還元法等の方法でニトロ基を還元して、一般式 (VIII) の化合物を得ることができる。

【0041】工程2においては、一般式 (VIII) の化合物をメタノール、テトラヒドロフラン等の適当な有機溶媒を用い、二炭酸ジーtert-ブチルでウレタン化するか、水又はアセトン、メタノール、テトラヒドロフラン等の有機溶媒あるいはこれらの混合溶媒を用い、トリエチルアミン、炭酸カリウム、炭酸ナトリウム、炭酸水素ナトリウム等の塩基の存在下、ベンジルオキシカルボニルクロリドを用いてウレタン化した後、テトラヒドロフラン、N、Nージメチルホルムアミド等の適当な非プロトン性有機溶媒中、一78℃から溶媒の加熱還流温度までの範囲で、n-ブチルリチウム等の塩基で処理し、次いてグリシジルブチレートを反応させることにより、一般

式(IX)の化合物を得ることができる。

【0042】工程3においては、一般式(IX)の化合物をメタンスルホニルクロリドを用いて、ジクロロメタン、テトラヒドロフラン等の有機溶媒中、トリエチルアミン等の塩基の存在下、氷冷下から溶媒の加熱還流温度までの範囲で反応することにより、一般式(X)の化合物を得ることができる。

【0043】工程4においては、一般式(X)の化合物をアジ化ナトリウムを用いて、テトラヒドロフラン、N、Nージメチルホルムアミド等の有機溶媒中、氷冷下から溶媒の加熱還流温度までの範囲で反応することにより、一般式(XI)の化合物を得ることができる。

【0044】又、一般式(X)の化合物において、置換されていてもよいフェニル基Aに置換する官能基の種類によっては、一般式(XI)の化合物内における置換基の変換も可能である。一般式(XI)内での置換基変換の一例を挙げると、例えば、Aが保護された窒素原子で置換されている置換フェニル基の場合、工程4のアジド化反応を行った後、保護された窒素原子の脱保護反応を行い、次いで脱保護アミノ基に適当なアルキル化反応、アシル化反応、ウレタン化反応等を行うことができる。脱

法により行うことができる。例えば、保護基がアシル基 等のようなアミド型保護基の場合には、酸又は塩基を用 いた加水分解反応により脱保護し製造することができ る。アミドの加水分解反応はそれ自体公知の方法で、酸 性加水分解には塩酸、硫酸、トリフルオロ酢酸等の酸を 用いることができ、塩基性加水分解には水酸化ナトリウ ム、水酸化カリウム等の塩基を用いることができる。こ れらの酸又は塩基は水溶液として用いることもできる が、メタノール, エタノール, n-ブタノール, sec-ブタ ノール, tert-ブタノール等のアルコール系溶媒、ジエ チルエーテル, ジイソプロピルエーテル, テトラヒドロ フラン等のエーテル系溶媒、酢酸メチル、酢酸エチル等 のエステル系溶媒等の有機溶媒中や含水有機溶媒中で行 うこともできる。又、窒素原子の保護基が低級アルコキ シカルボニル基のようなウレタン型保護基の場合には、 無溶媒、あるいは酢酸、酢酸エチル、1、4ージオキサ ン、水、メタノール、エタノール又はこれらの混合溶媒 中、塩酸、硫酸、臭化水素酸、トリフルオロ酢酸等の酸 で処理することにより脱保護し、製造することができ る。

【0045】脱保護されたアミノ基のアルキル化反応 は、塩基の存在下あるいは非存在下、適当な試薬とし て、例えば、ハロゲン化アルキルやアルカンスルホネー ト等によるアルキル化反応、あるいはアクリル酸エステ ルによるマイケル付加反応等により行われる。その他 に、塩基の存在下、ハロゲン化アシル等によるアシル化 反応、又はクロロ炭酸アルキル等によるウレタン化反応 等を行うことにより、一般式 (XI) の化合物を得ること ができる。

【0046】工程5においては、一般式(XI)の化合物 を適当な還元方法、例えば、酸化白金、パラジウム炭素 等の触媒を用いた水素化還元法、あるいはトリフェニル ホスフィン及び水を用いた方法でアジド基を還元して、 一般式 (IV) で示される化合物を得ることができる。

【0047】本発明の医薬は、前記一般式(Ⅰ)で示さ れるジチオカルバミド酸誘導体又はその塩を有効成分と して含むことを特徴としている。本発明の医薬の有効成 分としては、遊離形態の上記化合物及び生理学的に許容 しうる塩、並びにそれらの溶媒和物又はそれらの水和物 からなる群から選ばれる物質を用いることができ、2種 以上の物質を組み合わせて用いてもよい。本発明の医薬 としては、上記物質自体をそのまま用いてもよいが、通 常は、有効成分である上記物質と、1種又は2種以上の 製剤用添加物とを含む医薬組成物の形態として提供され ることが望ましい。

【0048】医薬組成物の形態は特に限定されないが、 例えば、カプセル剤、錠剤、細粒剤、顆粒剤、散剤、シ ロップ剤などの経口投与剤、あるいは注射剤、坐剤、点 眼剤, 眼軟膏剤, 点耳剤, 経皮粘膜吸収剤, 吸入剤又は

保護反応は、窒素原子の保護基の種類に応じて種々の方。外皮用剤などの非経口投与剤として調整することが可能 である。これらの製剤は、薬理学的、製剤学的に許容し うる添加剤を加え、常法により製造することができる。 即ち経口投与剤及び坐剤にあっては、賦形剤(乳糖、D -マンニトール、トウモロコシデンプン、結晶セルロー ス等),崩壊剤(カルボキシメチルセルロース,カルボ キシメチルセルロースカルシウム等)、結合剤(ヒドロ キシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセ ルロース、ポリビニルピロリドン等)、滑沢剤(ステア リン酸マグネシウム,タルク等),コーティング剤(ヒ ドロキシプロピルメチルセルロース、白糖、酸化チタン 等),可塑剤(ポリエチレングリコール等),基剤(ポ リエチレングリコール,ハードファット等)等の製剤用 成分が、注射剤、点眼剤、点耳剤にあっては水性あるい は用時溶解型剤型を構成しうる溶解剤ないし溶解補助剤 (注射用蒸留水, 生理食塩水, プロピレングリコール 等), p H調節剤 (無機又は有機の酸あるいは塩基), 等張化剤(食塩、ブドウ糖、グリセリン等)、安定化剤 等の製剤用成分が、又、眼軟膏剤、外皮用剤にあって は、軟膏剤、クリーム剤、貼付剤として適切な製剤用成 分(白色ワセリン、マクロゴール、グリセリン、流動パ ラフィン,綿布等)が使用される。

【0049】本発明の医薬は、例えば、抗菌剤又は抗真 菌剤としてヒトを含む哺乳類の感染症の治療又は予防の ために投与することができる。本発明の医薬の投与量は 特に限定されず、病原菌の種類、患者の年齢、体重、疾 患の重篤度などに応じて適宜の投与量を選択することが 可能である。通常成人の場合、1日量として、経口投与 で10~2000mg程度、非経口投与で1~1000mg 程度を1日1回ないしは数回に分けて投与することがで きる。もっとも、治療又は予防の目的、感染の部位や病 原菌の種類、患者の年齢や症状などに応じて、適宜増減 することが望ましい。

#### [0050]

【実施例】以下、本発明を参考例及び実施例によって説 明するが、本発明の範囲はこれらの例に限定されるもの ではない。尚、表中の略語は次の意味を表す。Me:メチ ル基, Et:エチル基, n-Pr:n-プロピル基, n-Bu:n-ブ チル基, Boc: tert-ブトキシカルボニル基, Z:ベンジ ルオキシカルボニル基, Ms: メタンスルホニル基, Bn: ベンジル基。

#### 【0051】参考例1

N-tert-ブトキシカルボニルー4ーピペリジノール 4-ピペリジノール50.0gの無水テトラヒドロフラ ン250ml懸濁液に氷冷攪拌下、二炭酸ジーtert-ブチ ル125回を加え30分間攪拌した。溶媒を減圧留去 し、淡黄色液体120.5gを得た。

NMRスペクトル (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.46(9H, s), 1.47-1.5 0(2H, m), 1.81-1.87(2H, m), 3.01-3.10(2H, m), 3.73-3.87(3H, m)

マススペクトル(m/z): 201(M+)

【0.052】参考例1と同様にして参考例2の化合物を

得た<del>。</del>

【0053】参考例2

N-tert-ブトキシカルボニル-3-アゼチジノール 性状: 黄色液体

NMRスペクトル (DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 1.37(9H, s), 3.55-3.60(2H, m), 3.95-4.00(2H, m), 4.30-4.40(1H, m), 5.50(1)H.d.J=6Hz)

IRスペクトル ν (liq.)cm<sup>-1</sup>:1678,3416

【0054】参考例3

N-tert-ブトキシカルボニルー4-メトキシピペリジ

60%水素化ナトリウム8.77gの無水N, N-ジメ チルホルムアミド300ml懸濁液に室温攪拌下、N-te - -rt-ブトキシカルボニルー4ーピペリジノール49.0 gの無水N, N-ジメチルホルムアミド190ml溶液を 加えた後、ヨウ化メチル30.4㎡を滴下し5時間攪拌。 した。反応液を氷水に加え、酢酸エチルで抽出した。抽 出液を飽和食塩水で洗浄し芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去 した。残渣をカラムクロマトグラフィー(シリカゲル、

酢酸エチル: n-ヘプタン=1:2→1:1) で精製し、

無色液体44.1 gを得た。

NMRスペクトル (CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.45-1.55(2H, m),1.4 6(9H,s),1.80-1.90(2H,m),3.05-3.15(2H,m),3.30-3.40 (1H, m), 3.35(3H, s), 3.70-3.80(2H, m)

I Rスペクトル ν (lig.)cm<sup>-1</sup>: 1698

マススペクトル(m/z):215 (M)

【0055】参考例4

N-tert-ブトキシカルボニル-3-(2-メトキシエ トキシ) アゼチジン

60%水素化ナトリウム0.25gの無水N, N-ジメ チルホルムアミド5回懸濁液に室温攪拌下、N-tert-プトキシカルボニル-3-アゼチジノール1.00gの 無水N、N-ジメチルホルムアミド3ml溶液を加えた 後、2-メトキシエチルメタンスルホネート0.98g の無水N, N-ジメチルホルムアミド2ml溶液を滴下し 4時間攪拌した。反応液を氷水に加え、酢酸エチルで抽 出した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄し芒硝乾燥 後、溶媒を減圧留去した。残渣をカラムクロマトグラフ ィー(シリカゲル, 酢酸エチル:n-ヘプタン=1:3) で精製し、無色液体0.67gを得た。

NMRスペクトル (DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 1.37(9H, s), 3.25(3 H,s, 3.41-3.45(2H,m), 3.46-3.49(2H,m), 3.64(2H,dd, J=

I Rスペクトル ν (Hig.)cm<sup>-1</sup>:1698,3684 9,4Hz),3.98(2H,dd,J=9,6.5Hz),4.21-4.26(1H,m) I Rス ペクトル ν (liq.)cm<sup>-1</sup>: 1706

【0056】参考例5

<del>4ーメトキシピペリジン・塩酸塩9%塩化水素酢酸エイ</del> ル溶液220mlに氷冷撹拌下、 N-tert-ブトキシカル ボニルー4-メトキシピペリジン43.9gの酢酸エチ ル220回溶液を加えた後、2.5時間攪拌した。析出 結晶を沪取し、無色結晶29.1gを得た。

NMRスペクトル(CDCl<sub>3</sub>) δ ppm: 1.95-2.05(2H,m), 2.10 -2.20(2H,m), 3.15-3.30(4H,m), 3.33(3H,s), 3.50-3.60(1)

IRスペクトル ν (liq.)cm<sup>-1</sup>: 3448

マススペクトル(m/z):115(M+)

【0057】参考例5と同様にして参考例6の化合物を

得た。

【0058】参考例6

3- (2-メトキシエトキシ) アゼチジン・塩酸塩

性状:淡黄色液体

NMRスペクトル(DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 3.26(3H,s),3.43(2 H, t, J=4.5Hz), 3.54(2H, t, J=4.5Hz), 3.75-3.80(2H, m), 4.05-4.10(2H,m), 4.35-4.40(1H,m)

I Rスペクトル ν (liq.)cm<sup>-1</sup>:3436

マススペクトル(m/z):131(M)

【0059】参考例7

3-フルオロー4ー(4-メトキシピペリジン-1-イ

<del>ル)ニトロベンゼン</del>

3, 4-ジフルオロニトロベンゼン15.0gとN, N ージイソプロピルエチルアミン41mlの無水アセトニト リル150回溶液に4-メトキシピペリジン・塩酸塩1 5.8gを加え5時間加熱還流した。溶媒を減圧留去 後、残渣に水及び10%水酸化ナトリウム水溶液を加え てアルカリ性とし、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽 和食塩水で洗浄し、芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去して黄 褐色液体24.1gを得た。

NMRスペクトル(DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm: 1.54-1.62(2H, m), 1.92-2.00(2H,m), 3.08-3.16(2H,m), 3.28(3H,s), 3.38-3. 46(1H,m), 3.49-3.57(2H,m), 7.16(1H,t,J=8.5Hz), 7.95(1H, dd, J=14, 3Hz), 7.97(1H, dd, J=8.5, 3Hz)

IRスペクトル ν(liq.) cm<sup>-1</sup>:1336,1518

マススペクトル(m/z):254(M<sup>+</sup>)

【0060】参考例7と同様にして参考例8から20の 化合物を得た。

[0061]

【表12】

	参考例	网络沙漠外外 人名	物性[再結晶溶媒]	<b>1</b> (2
			黄色針状晶[iso-PrOH]	
		EIO-(N-(-)-NO,	mp,62~63°C	
- 2 - 2	8	NO <sub>2</sub>	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>17</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	
•		the American	理論值 C,58.20;H,6.39;N,10.44	
•			実験值 C,58.10;H,6.60;N,10.45	
,			黄色結晶[iso-Pr <sub>2</sub> O-n-Heptane]	1
	1 m	MeO	mp,58.5∼59.5℃	1
	9	, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>19</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	
		F	理論值 C,56.37;H,6.42;N,9.39	
			<del>実験値</del> C,56.36;H,6.54;N,9.34	
•			黄褐色プリズム状晶[iso-Pr <sub>2</sub> 0]	
		Me-N N-NO-NO-	mp,68~68.5℃	*
	10		元素分析值 C <sub>11</sub> H <sub>14</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	
		F	理論值 C,55.22;H,5.90;N,17.56	
			実験値 C.55.24;H,5.71;N,17.63	
			黄色液体	
A CONTRACT OF THE CONTRACT OF			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:3.27(3H,s),3.47(2	
		MeO O N NO.	H.t.J=4:5Hz),3.56(2H,t,J=4.5Hz),3.95-	
	11	٠. سر ٧	4.00(2H,m),4.35-4.40(2H,m),4.45-4.50	
			(1H,m),6.57(1H,t,J=9Hz),7.89(1H,dd,J=	
			13,2.5Hz),7.93(1H,dd,J=9,2.5Hz)	
		·	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1326,1532	
			MS(m/z):270(M*)	
***************************************		Ma N	黄色結晶[EtOH]	
•	12	N-NO <sub>2</sub>	mp.193~194℃	
	\ \frac{1}{2}	F	元素分析值 C <sub>1.1</sub> H <sub>16</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub> ·HCl 理論值-C,47-57;H,6.17;N,15,13	
		· HCl	実験值 C,47.30;H,5.89;N,15.08	
and the state of t	· · · · ·		英褐色液体	
•			NMR(DMSO- $d_6$ ) $\delta$ ppm:1.50-1.60(4H,m),	
			1.70-1.85(4H,m),3.55-3.65(4H,m),6.96	
	13	N—NO <sub>2</sub>	(1H,t,J=9Hz),7.88(1H,dd,J=16,3Hz),7.9	*
			0(1H,dd,J=9,3Hz)	
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1324,1522	
. •		to the state of th	MS(m/z):238(M*)	a pie de la companya
[0062]			I-trao.	

[0062]

【表13】

the sample. The second	参考例		物性[再結晶溶媒]	
			黄褐色液体	
		会員を発生されておりました。	NMR(DMSO- $d_a$ ) $\delta$ ppm:0.95(3H,d,J=6Hz),	
	<del> </del>		1.20-1.35(2H,m),1.55-1.65(1H,m),1.65-	·
		Me—NO <sub>2</sub>	-1.80(2H,m),2.85-3.00(2H,m),3.60-3.7	
::	14		5(2H,m),7.13(1H,t,J=9Hz),7.93(1H,dd,J	
•	:	}. <b>F</b>	=13.5,2.5Hz),7.97(1H,dd,J=9,2.5Hz)	
•			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1334,1512	
•			MS(m/z):238(M <sup>+</sup> )	
	<b>—</b>	-	黄褐色液体	
	<u>-</u>	-	NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) δ ppm:0.93(3H,t,J=7.5H	<b>_</b>
,	1		z),1.25-1.45(5H,m),1.82(2H,d,J=5.5Hz)	
•	1	5. July 2	.2.86(2H,t,J=12Hz),3.71(2H,d,J=12Hz),	
	15	E1	6.91(1H,t,J=9Hz),7.88(1H,dd,J=13.5,2.	
		F	5Hz),7.96(1H,dd,J=9,2.5Hz)	
			IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1338,1518	
			MS(m/z):252(M <sup>+</sup> )	
			黄色板状晶[iso-PrOH]	İ
			mp.109.5~111.5°C	
_	16	Bn N NO2	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	
	10		理論值 C,68.77;H,6.09;N,8.91	
			実験値 C,68.77;H,6.03;N,8.84	
	<del> </del>		黄色針状晶[iso-PrOH]	1
	_		mp,95~96°C	ļ
	17	Me <sub>2</sub> N-NO <sub>2</sub>	元素分析值 CaHaFN2O2	
			理論值 C,52.17;H,4.93;N,15.21	ļ ·
		•	実験值 C,51.93;H,4.72;N,15.21	İ
			黄色針状晶[n-Heptane]	<del> </del>
••		Et 🗇	mp,40~41°C	
	18	NO <sub>2</sub>	元素分析值 CaHiiFN2O2	<b>t</b> :
	'0'	Me F	理論值 C,54.54;H,5.59;N,14.13	
	8		実験値 C,54.26;H,5.76;N,14.19	
,			黄色プリズム状晶[n-Heptane]	1.
•			mp,49.5~50.5℃	1
	19	Et <sub>2</sub> N-\ \ \ \ \ NO <sub>2</sub>	元素分析值 C <sub>10</sub> H <sub>13</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	
• •			理論值 C,56.60;H,6.17;N,13.20	
			実験値 C,56.41;H.6.01;N.13.06	1
•	-		黄色結晶[Acetone]	1 .
			mp,200~202°C	
· .	20	[ ] N-( )-NO <sub>2</sub>	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>11</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	
ř.	20		理論值 C,65.11;H,4.29;N,10.85	
			実験値 C,65.25;H,4.09;N,10.85	
	<u> </u>	<u></u>		J .

### 【0063】参考例21

4-(2-ジメチルアミノエトキシ)-3-フルオロニトロベンゼン

60%水素化ナトリウム1.38gの無水テトラヒドロフラン10ml懸濁液に、氷冷撹拌下、2ージメチルアミノエタノール3.50mlの無水テトラヒドロフラン10ml溶液を滴下した。同温で30分間撹拌した後、3.4ージフルオロニトロベンゼン5.00gの無水テトラヒドロフラン30ml溶液を滴下し、室温で30分間撹拌した。反応液を氷水に加えた後、水層を酢酸エチルで抽出

した。抽出液を水、飽和食塩水で順次洗浄し芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をカラムクロマトグラフィー(シリカゲル、ジクロロメタン:メタノール=10:1)で精製し、黄褐色液体7.60gを得た。NMRスペクトル(CDCl<sub>3</sub>) δ ppm; 2.36(6H,s),2.82(2H,t,J=5.5Hz),4.24(2H,t,J=5.5Hz),7.05(1H,t,J=9Hz),8.00(1H,dd,J=10.5,2.5Hz),8.05(1H,dd,J=9,2.5Hz) IRスペクトル レ (liq.)cm<sup>-1</sup>:1348,1526マススペクトル(m/z):228(M\*)

## 9の化合物を得た。 【0065】

## 37 man 【表1·4 】 5 man an

· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·				
	参考例	The second secon	物性[再結晶溶媒]	
*		4	褐色液体	İ
	e e tare	BOAR STORES OF A TORES	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm: 0.99(3H,t,J=7.5	
			Hz).1.77(2H,sex,J=7.5Hz).4.09(2H,t,J=	
	22	n.Pro-		· .
		11.10	7.5Hz),7.13(2H,d,J=9Hz),8.18(2H,d,J=	· ·
•			9Hz)	·
	-		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1342,1514	
•		·	MS(m/z):181(M <sup>+</sup> )	
			褐色液体	<u> </u>
			NMR(CDCl <sub>3</sub> ) $\delta$ ppm:7.07(1H,dd,J=9,8Hz),	i i
·			7.35-7.45(2H,m),8.05(1H,dt,J=10,2.5H	
	23	NO <sub>2</sub>	z),8.13(1H,dd,10,2.5Hz),8.49(1H,d,J=3	
	1	F	Hz),8.53(1H,dd,J=4.5,1Hz)	· ·
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1352,1530	
* \		<u>.</u>	MS(m/z):234(M*)	
			黄色針状晶[iso-Pr.O]	
	1.70	-	mp,62.5~63℃	
	24	MeO O NO2		
			元素分析值 C <sub>0</sub> H <sub>10</sub> FNO <sub>4</sub>	
		, v <b>F</b> ,	理論值 C.50.24;H,4.68;N,6.51	
			実験値 C,50.18;H,4.54;N,6.50	
		·	黄褐色液体	
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> )-&-ppm:1-91 <del>(2</del> H,quin,J=6	
		Me-N O NO.	5Hz),2.15(6H,s),2.37(2H,t,J=6.5Hz),4.2	
	25	)	5(2H,t,J=6.5Hz),7.40(1H,t,J=9Hz),8.07	
		F F	-8.13(2H,m)	
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1348,1526	<del></del>
			MS(m/z):242(M <sup>+</sup> )	
		A Commence of the Commence of	黄褐色液体	_
5		<u></u>	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.55(2H,quin,J=7	
		Me <sub>2</sub> N O NO,	Hz).1.79(2H.quin.J=7Hz).2.12(6H.s).2.	
•	26	<b>)</b> —	25(2H,t,J=7Hz),4.23(2H,t,J=7Hz),7.40(	
			1H,t,J=9Hz),8.06-8.13(2H,m)	
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1346,1528	
		Louis Ser Factor	MS(m/z):256(M*)	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
	****		黄色結晶[EtOH]	i
		Me <sub>2</sub> N	mp.170~172°C	
	27	S—NO <sub>2</sub>	元来分析值 C <sub>10</sub> H <sub>13</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S·HCI	
	1	[	70ポンツ  性 V <sub>18</sub> П <sub>13</sub> ГN <sub>2</sub> V <sub>2</sub> 3"    U	
	1	- HCI	理論值 C.42.78;H.5.03;N.9.98	
•	L		実験値 C,42.60;H,4.92;N,9.93	

[0066]

【表15】

.•	参考例	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	物性[再結晶溶媒]
			淡黄色柱状晶[iso-PrOH]
	:	Boc-N -O-NO,	mp,91.5~93℃
	28		元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub>
		<b>F</b>	理論值 C,56.46;H,6.22;N,8.23
:			実験値 C,56.36;H,6.34;N,8.29
			淡黄色針状晶[EtOH]
	İ	^ /=\	mp,117~117.5℃
	29	Boc-NO2	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>17</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub>
		F	理論值 C,53.84;H,5.49;N,8.97
_		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	実験値 C,53.73;H,5.44;N,8.97

【0067】参考例30

3- (2-メトキシエトキシ) -4- (モルホリン-4 -イル) ニトロベンゼン

60%水素化ナトリウム4.80gの無水N,Nージメチルホルムアミド180ml懸濁液に室温下、2ーメトキシエタノール6.90mlを滴下した後、3ーフルオロー4ー(モルホリンー4ーイル)ニトロベンゼン18.0gを加え、室温下、2時間攪拌した。反応液を氷水に加え、析出した結晶を沪取し黄褐色結晶19.7gを得た。イソプロパノールから再結晶して、融点109~110℃の黄色針状晶を得た。

元素分析值 C<sub>13</sub> H<sub>18</sub> N<sub>2</sub> O<sub>5</sub>

理論値 C,55.31; H,6.43; N,9.92

実験値 C,55.23; H,6.29; N,9.98

【0068】参考例30と同様にして参考例31の化合物を得た。

【0069】参考例31

4-(モルホリン-4-イル)-3-n-プロポキシニトロベンゼン

性状 黄色プリズム状晶 (再結晶溶媒: E t<sub>2</sub>O)

融点 110~111℃.

元素分析值 C<sub>13</sub>H<sub>18</sub>N<sub>2</sub>O<sub>4</sub>

理論値 C,58.63; H,6.81; N,10.52

実験値 C,58.62; H,6.90; N,10.53

【0070】参考例32

4-(2-ジメチルアミノエトキシ)-3-フルオロア

ユリシ ……

4-(2-ジメチルアミノエトキシ)-3-フルオロニトロベンゼン2.00gと酸化白金0.02gのメタノール懸濁液を、常温で水素圧2kg/cm²下1.5時間接触還元を行った。触媒を沪去後、沪液を減圧濃縮し黄褐色液体1.78gを得た。

NMRスペクトル(DMSO-d<sub>6</sub>) δ ppm; 2.20(6H,s),2.56(2 H,t,J=6Hz),3.93(2H,t,J=6Hz),4.82(2H,br-s),6.28(1H,dd,J=9,2.5Hz),6.41(1H,dd,J=13.5,2.5Hz),6.82(1H,t,J=9Hz)

IRスペクトル ν (liq.)cm<sup>-1</sup>:3352

マススペクトル (m/z):198(M+)

【0071】参考例32と同様にして参考例33から56の化合物を得た。

[0072]

【表16】

	参考例	经有新的基础转换的 电影不知 的现在分词	物性[再結晶溶媒]	and the manifest of the second
			黒色液体	
* * * * * * * * * * * * * * * * * * * *			NMR(DMSO- $d_8$ ) $\delta$ ppm:1.49-1.59(2H,m),	
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·			1.86-1.94(2H,m),2.59-2.67(2H,m),2.97	
	., .		-3.04(2H,m),3.22-3.29(1H,m),3.25(3H,	
	33	MeU-NH2	s),4.83(2H,br-s),6.29(1H,dd,J=8.5,2.5H	
		F	z),6.33(1H,dd,J=14.5,2.5Hz),6.75(1H,t,	
			J=8.5Hz)	
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3360,3448	, .
			MS(m/z):224(M*)	
			黒褐色液体	<u> </u>
			NMR(DMSO- $d_6$ ) $\delta$ ppm:1.11(3H,t,J=7.5H	
			z),1.50-1.60(2H,m),1.85-1.95(2H,m),2.	
			60-2.70(2H,m),2.95-3.05(2H,m),3.30-3	
	34	EtO N-NH2	.40(1H,m),3.47(2H,q,J=7.5Hz),4.83(2H,	
		F	br-s),6.30(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),6.30(1H,	
			dd,J=14,5,2.5Hz),6.75(1H,dd,J=9.5,8.5	
			Hz)	
	1		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3360,3456	
1. 1			MS(m/z):238(M*)	
			褐色液体	
•			NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:1.50-1.60(2H,m),	
			1.85-1.95(2H,m),2.60-2.65(2H,m),2.95 -3.05(2H,m),3.26(3H,s),3.35-3.40(1H,	· .
		MeO NH	-3.05(2H, m), 3.25(3H, s), 3.33-3.40(1H, m), 3.44(2H, t, J=5Hz), 3.54(2H, t, J=5Hz),	
	35		-4.83(2H,br-s),6.28(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),	
			6.32(1H,dd,J=14.5,2.5Hz),6.75(1H,t,J=	
			8-5Hz)	
			IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :3364,3464	
a and a construct of the same of			MS(m/z):268(M*)	
Own			茶褐色プリズム状晶[iso-Pr <sub>2</sub> O]	
			mp,87~88°C	
•	36	Me-N N-NH <sub>2</sub>	元素分析值 C <sub>11</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub>	
		F .	理論值 C,63.13;H,7.71;N,20.08	
			実験値 C,63.10;H,7.46;N,20.08	No.
				Table and the second of the

[0073]

【表17】

and the second of the second	参考例		物性[再結晶溶媒]	
	<u> </u>		黒紫色液体	-
	and the		NMR(DMSO- $d_0$ ) $\delta$ ppm:1.50-1.65(4H,m),	· ·
			1.65-1.75(4H,m),3.07(4H,t,J=6Hz),4.70	
	37	N-( )-NH2	(2H,br-s),6.26(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),6.31	:
	3,		(1H,dd,J=14.5,2.5Hz),6.71(1H,t,J=8.5H	
	٠.	F ·	z),	i
		·	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3224,3356	
			MS(m/z):208(M <sup>+</sup> )	
	·		黒色液体	
	•		NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:0.93(3H,d,J=6.5H	_
		<b>,</b>	z),1.20-1.30(2H,m),1.35-1.50(1H,m),1.	
	ł		60-1.70(2H,m),2.45-2.60(2H,m),3.00-3	
	.38	Me N-NH <sub>2</sub>	.10(2H,m),4.81(2H,br-s),6.28(1H,dd,J=	
		<b>F</b>	9,2.5Hz).6.32(1H,dd,J=14.5,2.5Hz).6.7	
. 1			4(1H,t,J=9Hz),	
· ·			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3224,3356,3464	
•		<u> </u>	MS(m/z):208(M*)	<u>.</u>
			<b>黒色液体</b>	-
		da	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:0.91(3H,t,J=7.5Hz),1	
		1.	.15-1.30(1H,m),1.32(2H,quin,J=7.5Hz),	
•			1.38(1H,dd,J=12,4Hz),1.43(1H,dd,J=12	
	39	Et-\ N-\ NH <sub>2</sub>	,4Hz),1.76(2H,d,J=4Hz),2.56(2H,td,J=1	
	33		1.5,2Hz),3.26(2H,d,J=11.5Hz),3.34(2H,	
	`	1.	br-s),6.39(1H,dd,J=9,2.5Hz),6.42(1H,d	
			d,J=13.5,2.5Hz),6.82(1H,t,J=9Hz),	:
	ĺ		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3352,3464	
			MS(m/z):222(M*)	
			褐色結晶[DMF-H₂O]	
			mp,92~93.5°C	
	40	Bh—NH <sub>2</sub>	元素分析值 C,,,H <sub>2</sub> ,FN,	
		F ·	理論值 C,76.02;H,7.44;N,9.85	
		·	/ 実験値 C,75.88;H,7.43;N,9.82	
9			黒色液体	
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:3.25(3H,s),3.40-3	
		MeO O N-NH3	.45(4H,m),3.50(2H,t,J=4.5Hz),3.90-4.0	
	41	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	0(2H,m),4.25-4.35(1H,m),4.61(2H,br-s	
			),6.25-6.35(3H,m)	
			IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :3360,3430	
			MS(m/z):240(M <sup>+</sup> )	
		.1	1	

[0074]

. 【表18】

	参考例: 《李海游学校会》 (1992年) - 物性[再結晶溶媒] (1993年)		物性[再結晶溶媒]
			黒色液体
		a thirtie a state of the control of	NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) $\delta$ ppm:0.99(3H,t,J=7.5H
			z),1.72(2H,sex,J=7.5Hz),2.82(4H,t,J=5
	N	The second of th	Hz),3.67(4H,t,J=5Hz),3.83(2H,t,J=7.5H
	42	N-NH <sub>2</sub>	z),4.59(2H,br-s),6.09(1H,dd,J=8.5,2.5H
		n-PrO	z),6.23(1H,d,J=2.5Hz),6.59(1H,d,J=8.5
			Hz)
			IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :3356,3448
		-	MS(m/z):236(M*)
			淡紫色結晶[iso-PrOH-n-Hexane]
			mp,91.5~92°C
٠.	43	O_N—NH₂	1 •
	43	7-0	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>20</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>
		MeO/	理論值 C,61.88;H,7.99;N,11.10
	1		実験値 C.61.72;H.7.93;N,11.05
			淡褐色結晶[EtOH]
		N= N-N-N-N-12	mp,193~195℃
	44	F	元素分析值 C <sub>11</sub> H <sub>s</sub> FN <sub>2</sub> O-2HCl
•		• 2HCI	理論值 C,47.67;H,4.00;N,10.11
		- Znci	実験値 C,47.70;H,3.83;N,10.12
÷			褐色液体
	. (		NMR(DMSO-d <sub>6</sub> )δ ppm:0.94(3H,t,J=7.5H
			z),1.65(2H,sex,J=7.5Hz),3.77(2H,t,J=7.
	45	n-PrO-NH <sub>2</sub>	5Hz),4.46(2H,br=s),6.50(2H,d,J=9Hz),6
	1		.63(2H,d,J=9Hz)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3368,3440
			MS(m/z):151(M <sup>+</sup> )
<u> </u>			黒褐色液体
. •	1	5 1 5 196 F	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:3.44(3H,s),3.49(2H,b
	1	MeO O-NH	r-s).3.71(2H,t,J=5Hz),4.10(2H,t,J=5Hz
	46	mind — Ming	),6.30-6.40(1H,m),6.45(1H,dd,J=12.5,2
		F	.5Hz),6.84(1H,t,J=8.5Hz)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3368,3460
•			MS(m/z):185(M*)
			褐色液体
* . **.	<u>.</u>		NMR(DMSO-d <sub>B</sub> ) 8 ppm:1.77(2H,quin,J=7
	1		Hz),2.12(6H,s),2.32(2H,t,J=7Hz),3.88(2
	47	Me <sub>2</sub> N O NH <sub>2</sub>	H.t.J=7Hz).4.81(2H,br-s).6.29(1H,ddd,
·	47	<b>)</b>	J=9.5,2.5,1.5Hz),6.38(1H,dd,J=13.5,2.5
		F .	Hz),6.80(1H,t,J=9.5Hz)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3216,3360
			MS(m/z):212(M*)
[0075]	<u> </u>		[集10]

【表19】

A market services of the servi	参考例	विकास समिति है । इस	物性[再結晶溶媒]
•			赤褐色液体
		1	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.50(2H,quin,J=7
	ļ	Me <sub>2</sub> N	— Hz),1.65(2H,quin,J=7Hz),2.11(6H,s),2.
	48		22(2H,t,J=7Hz),3.87(2H,t,J=7Hz),4.80(
	76	F	2H,br-s),6.29(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),6.39(
		·	1H,dd,J=13.5,2.5Hz),6.80(1H,t,J=8.5Hz
•	<b>[</b>		)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3212,3360
			<b>黑色液体</b>
-		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:2.24(6H,s),2.43(2H,t,
		Me <sub>2</sub> N	J=7.5Hz),2.75(3H,s),3.08(2H,t,J=7.5Hz
•	49	N-NH <sub>2</sub>	),3.54(2H,br-s),6.35-6.45(2H,m),6.84(1
		F	H,t,J=9Hz)
			IR ν (liq.) om <sup>-1</sup> :3216,3336
	1 .		MS(m/z):211(M <sup>+</sup> )
			赤褐色液体
			NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:2.23(6H,s),2.47(2H,t,
		Me <sub>2</sub> N S NH	J=7.5Hz),2.85(2H,t,J=7.5Hz),3.83(2H,b
	50	]	r-s),6.35-6.45(2H,m),7.24(1H,t,J=8Hz)
		, F	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3212,3352,3464
			MS(m/z):214(M*)
•			淡緑色結晶
	<u> </u>		NMR(DMSO-d <sub>6</sub> )-8-ppm:2:58(6H;s),4:79(2-
•	:	Me <sub>2</sub> N-\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	H,br-s),6.30(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),6.33(1
	51	in agricultural and a second an	H,dd,J=14,2.5Hz),6.73(1H,t,J=8.5Hz)
	•	· F	IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :3328,3456
			MS(m/z):154(M*)
			黒紫色液体
·			無条色水体 NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:0.95(3H,t,J=7.5H
		Me 🥏	z),2.57(3H,s),2.88(2H,q,J=7.5Hz),4,82(
•	52	N-NH <sub>2</sub>	
	32	Et'	2H,br-s),6.29(1H,dd,J=9,2.5Hz),6.32(1 H,dd,J=16,2.5Hz),6.75(1H,t,J=9Hz)
}	1	F .	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :3224,3348
	}		
			MS(m/z):168(M <sup>+</sup> )
			灰褐色結晶
•		FA. 11 / - \	NMR(DMSO- $d_{\rm s}$ ) $\delta$ ppm:0.89(6H,t,J=7Hz),
	53	EGN-NH2	2.91(4H.q,J=7Hz).4.89(2H,br-s),6.25-6
		F -	.35(2H,m),6.78(1H,t,J=9Hz)
			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :3208,3332
•	1	1.	MS(m/z):182(M*)

[0076]

【表20】

参考例	an eine die Brahalte Brahalte	物性[再結晶溶媒]
		茶褐色液体
		NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:1.40(9H,s),1.45-1 .55(2H,m),1.75-1.85(2H,m),3.05-3.20(
54	Boc-N NH <sub>2</sub>	2H,m),3.55-3.70(2H,m),4.05-4.15(1H,m),4.90(2H,br-s),6.29(1H,ddd,J=8.5,2.5,
		1Hz),6.38(1H,dd,J=13.5,2.5Hz),6.84(1H ,t,J=8.5Hz)
		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1682,3368 MS(m/z):310(M <sup>+</sup> )
55	Boc-NO-O-NH <sub>2</sub>	黄褐色プリズム状晶[iso-Pr₂O] mp.85.5~86℃
 33	<b>f</b> .	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub> 理論值 C,59.56;H,6.78;N,9.92 実験值 C,59.43;H,7.06;N,9.89
56	N-(-)-NH <sub>2</sub>	淡紫色板状晶[AcOEt-n-Heptane] mp,81~82℃ 元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>13</sub> FN <sub>2</sub>
		元系万引道 C(4H <sub>13</sub> FN <sub>2</sub> 理論値 C;73.66;H.5.74;N,12.27 実験値 C,73.59;H,5.49;N,12.29

【0077】参考例57 N-ベンジルオキシカルボニル-4- (チオモルホリン -4-イル) アニリン4-(チオモルホリン-4-イ ル) アニリン19.0gの10%炭酸ナトリウム水溶液 190mlとアセトン190mlの混液に氷冷攪拌下、ベン ジルオキシカルボニルクロリド21.0㎡を滴下した。 室温で30分間攪拌した後、析出結晶を沪取し、ジイソ プロピルエーテルで洗浄し、淡褐色結晶25.5gを得 た。酢酸エチルージイソプロピルエーテルの混液から再

結晶し、融点145~146.5℃の無色針状晶を得 た。 元素分析值 C<sub>18</sub>H<sub>20</sub>N<sub>2</sub>O<sub>2</sub>S

理論値 C,65.83; H,6.14; N,8.53 実験値 C,65.69; H,6.12; N,8.38

【0078】参考例57と同様にして参考例58から8 8の化合物を得た。

[0079]

【表21】

		The state of the s		<u>in the state of t</u>
	参考例		物性[再結晶溶媒]	
			淡紫色針状晶[iso-PrOH]	
			mp,120~121°C	
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	58	N-NHZ	元素分析值 CiaHiaFN2O2	
		F	理論値 C,68.77;H,6.09;N,8.91	
			実験値 C.68.88;H.6.00;N.8.88	
·			無色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	
•		MeO-N-NHZ	mp,107~108℃	
	59	MeoMIIZ	元素分析值 C₂₀H₂₃FN₂O₃	
		<b>f</b>	理論值 C,67.02;H,6.47;N,7.82	
			実験値 C,66.90;H,6.35;N,7.73	
			淡紫色結晶[iso-PrOH]	
		ENO. NUT	mp,123.5∼125℃	
	60		元素分析值 C <sub>21</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	
		· F	理論值 C.67.72;H.6.77;N.7.52	
)			実験値 C,67.63;H,6.81;N,7.47	
		_	淡褐色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	* .
		N-NHZ	mp.78~78.5℃	
	61		元素分析值 C <sub>20</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	in pain in
		F	理論值 C,70.15;H,6.77;N,8.18	
•			実験値 C,70.10;H,6.77;N,8.17	<del></del>
•			淡紫色針状晶[AcOEt-iso-Pr₂O]   mp,124.5~126℃	
	62	Me— N— NHZ	mp,124.5~120 C   元素分析值 C,0H,3FN,O,	
•	02	حر ت	理論值 C,70.15;H,6.77;N,8.18	
<u>:</u>	1		実験値 C.70.11;H,6.83;N,8.12	
•			淡紫色針状晶[iso-PrOH]	<del> </del>
	-		mp,114~115°C	
	63	Et—\ N—\ NHZ	元素分析值 C21H25FN2O2	
	1:	- I in the second	理論值 C,70.76;H,7.07;N,7.86	
			実験値 C,70.66;H,7.17;N,7.84	
			淡褐色針状晶[iso-PrOH]	<del></del> 1:
			mp,113.5~115℃	
·)	64	N-V-NHZ	元素分析值 C₂₀H₂ァFN₂O₂	
	1	F F	理論值 C,74.62;H,6.50;N,6.69	
•		The second of th	▽ 実験値 C,74.51;H,6.23;N,6.68	
		· ·		

[0080]

【表22】

The state of the s	参考例	The state of the s	物性[再結晶溶媒]	
		(1) 14 · 大学和《 (2) · (4) · (4)	淡褐色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	
		MeO Sur	mp,97~98.5℃	
	65	- NAZ	元素分析值 C22H27FN2O4	
		r marin park from park	理論值 C,65.66;H,6.76;N,6.96	
			実験值 C,65.59;H,6.98;N,6.96	
			無色針状晶[iso-PrOH]	1
		Me-N N-NHZ	mp,136.5~137℃	
	66	Mas-NN	元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	,
		<b>,</b> , , , , , , , <b>, , , , , , , , , , ,</b>	理論值 C,66.46;H,6.46;N,12.24	
			実験値 C,66.50;H,6.49;N,12.14	
	·	* *	淡黄色針状晶[iso-Pr2O]	1
. ,		O N-NHZ	mp,110~111℃	* * *,*
	67	\ \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	元素分析值 C <sub>21</sub> H <sub>26</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	
	;	n-PrO	理論值 C,68.09;H,7.07;N,7.56	
			実験値 C,67.91;H,7.01;N,7.55	
•			無色針状晶[Et <sub>2</sub> O-iso-Pr <sub>2</sub> O]	· .
		O N- NHZ	mp,79.5~80.5℃	
	68		元素分析值 C <sub>21</sub> H <sub>26</sub> N <sub>2</sub> O <sub>5</sub>	
		MeO	理論值 C.65.27;H.6.78;N,7.25	
			実験值 C.65.12;H,6.67;N,7.25	
	·		無色針状晶[iso-PrOH]	
			mp,67~67.5°C	
	69	Et-(	元素分析值 CtaHt7NO2	
			理論值 C,75.27;H,6.71;N,5.49	
			実験値 C,75.19;H,6.82;N,5.52	
			無色結晶[iso-PrOH]	
	70	n-Pro-( NHZ	mp,110~111℃	a no more than Associate and for the last of the last
	,,,	II-PIO———NHZ	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>18</sub> NO <sub>3</sub>	
: "		The state of the second of the	理論值 C.71.56;H.6.71;N.4.91	
•			実験値 C,71.52;H,6.79;N,4.96 無色結晶[n-Hexane]	
• •	ŀ		旅出福山n-Hexane]   mp.59.5~60.5℃	
	71	n-Ru NH7	mp.59.5~60.5 C   元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>21</sub> NO,	,
	1	"Total	元素分析道 C <sub>18</sub> H <sub>21</sub> NO <sub>2</sub>   理論値 C,76.29;H,7.47;N,4.94	
			李論地 C,76.29;H,7.47;N,4.94 ☆実験値 C,76.31;H,7:56;N,4:97	
		1		

[0081]

【表23】

	参考例		物性[再結晶溶媒]	
			無色結晶[iso-Pr,0]	
			mp,77.5∼78℃	
	72	Me—\_NHZ	元素分析值-G <sub>16</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>2</sub>	
		Me	理論值 C,75.27;H,6.71;N,5.49	J
			実験値 C,75.16;H,6.63;N,5.51	ĺ
			無色結晶[iso-Pr,O]	
			mp,84~84.5°C	
•	73	F—NHZ	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>11</sub> F <sub>2</sub> NO <sub>2</sub>	
			理論值 C,63.88;H,4.21;N,5.32	Ī
	<del></del>	<u> </u>	実験値 C,64.09;H,4.15;N,5.31	
•			無色針状晶[iso-Pr <sub>2</sub> O]	
			mp,123~124.5°C	
•	. 74	F <sub>3</sub> C-\(\bigcap_\)-NHZ	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>12</sub> E <sub>3</sub> NO <sub>2</sub>	
* * * * * * * * * * * * * * * * * * * *			理論值 C,61.02;H,4.10;N,4.74	
7			実験值 C,61.12;H,4.04;N,4.74	
			無色針状晶[AcOEt-n-Hexane]	
			mp,107~108℃	
	75	NHZ	元素分析值 C <sub>20</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>3</sub>	
			理論值 C,75.22;H,5.37;N,4.39	
·	İ		実験値 C,75.32;H,5.43;N,4.38	
			淡褐色針状晶[EtOH]	
		NHZ	mp,173~175℃	
,	76		元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>15</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub> -HCl	
	1		理論值 C,60.89;H,4.30;N,7.47	1
		- HCI	実験値 C,60.84;H,4.26;N,7.45	•
			無色結晶[AcOEt]	
1	1.22	MeG 0-	mp,91~92℃	
	77		元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>18</sub> FNO <sub>4</sub>	
		<b>f</b>	理論值 C,63.94;H,5.68;N,4.39	* · · · · ·
•			実験値 C,63.71;H,5.59;N,4.35	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
:. ·			淡黄褐色プリズム状晶[iso-Pr <sub>2</sub> O	]
Market 1		Man O-NHZ	mp,81.5~82℃	
,	78		元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	
		F	理論值 C,65.05;H,6.37;N,8.43	-
•			実験値 C.64.93;H.6.37;N,8.46	
	1		黄褐色結晶[iso-Pr₂O]	
		Me_N O NHZ	mp,74∼75°C	
	79		元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	
		F	理論值 C,65.88;H,6.69;N,8.09	1
	L		実験値 C,65.86;H,6.67;N,7.98	

[0082]

【表24】

	参考例		物性[再結晶溶媒]
			赤褐色液体
			NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) 8 ppm:1.52(2H,quin,J=7
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	A 15 10	Me <sub>2</sub> N ONHZ	Hz),1.70(2H,quin,J=7Hz),2.11(6H,s),2.
	80	<u> </u>	23(2H,t,J=7Hz),3.99(2H,t,J=7Hz),5.14(
		•	2H.s),7.06(1H,t,J=9Hz),7.14(1H,dd,J=9
•			,1Hz),7.30-7.42(6H,m),9.62(1H,br-s)
		*	IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1730
			褐色液体
			NMR(GDCl <sub>3</sub> ) & ppm:2.25(6H,s),2.47(2H,t,
			J=7.5Hz),2.81(3H,s),3.18(2H,t,J=7.5Hz
		Me <sub>2</sub> N N-NHZ	),5.19(2H,s),6.59(1H,br-s),6.86(1H,t,J
•	81	Mo S	=9.5Hz),6.94(1H,d,J=9.5Hz),7.20-7.25(
		F	1H,m),7.30-7.45(5H,m)
the state decrease prior states in the suppression of the state of the			IR v (liq.) cm <sup>-1</sup> :1732,3180,3320
		3 4 4 4 4	MS(m/z):345(M*)
			黄褐色液体
			NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:2.24(6H,s),2.50(2H,t,
		Me <sub>2</sub> N _	J=7.5Hz),2.94(2H,t,J=7.5Hz),5.20(2H,s
	82	S—NHZ	),6.83(1H,br-s),6.98(1H,dd,J=8.5,2.5Hz
		F F	),7.25-7.45(7H,m)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1734,3332
			MS(m/z):348(M*)
			無色針状晶[iso-PrOH]
			mp,100~100.5°C
	83	NHZ	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>2</sub>
			理論值 C,76.84;H,6.81;N,4.98
and the second s			実験値 C.76.85;H.7.07;N,4.98
•	İ	·	無色結晶[AcOEt−iso−Pr₂O]
			mp.106.5~107.5℃
	84	Me <sub>2</sub> N————————————————————————————————————	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>
			理論值 C,71.09;H,6.71;N,10.36
			実験値 C,71.15;H,6.89;N,10.35
			灰色結晶
		_1_ %	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:3.64(6H,s),5.03(2
		Me N NHZ	H.s),7.13(2H,d,J=7.5Hz),7.26(1H,dd,J=
	85		9,2.5Hz),7.30-7.55(4H,m),7.70-7.75(1
		: <b>F</b>	H,m),10.3(1H,br-s)
			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1740
			MS(m/z):288(M*)
			無色結晶[AcOEt-n-Heptane]
		N—NHZ	mp,60~61℃
	86	Et'	元素分析值 C <sub>1</sub> ,H <sub>19</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>
		F	理論值 C.67.53;H.6.33;N.9.27
.5			実験値 C,67.32;H,6.33;N,9.29

[0083]

【表25】

	40.00	<del>rain des crises en la company de la comp</del>	<del></del>		
	参考例		物性[再結晶溶媒]		
_			黑褐色液体		
,	in the	er ver <u>ter</u> beginning	NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:0.96(6H,t,J=7.5H		
		Et <sub>2</sub> N-\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\			
	87		黒褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>g</sub> ) & ppm:0.96(6H,t,J=7.5Hz),3.06(4H,q,J=7.5Hz),5.15(2H,s),6.95(1H,t,J=9Hz),7.12(1H,dd,J=9,2Hz),7.25-7.45(6H,m),9.62(1H,br-s) IR ν(liq.) cm <sup>-1</sup> :1706 MS(m/z):316(M*) 赤褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>g</sub> ) & ppm:1.40(9H,s),1.49-1 -NHZ -NHZ -NHZ -NHZ -NHZ -NHZ -NHZ -NHZ		
	•	F	-7.45(6H,m),9.62(1H,br-s)		
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1706		
			MS(m/z):316(M <sup>+</sup> )		
			赤褐色液体		
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> )δ ppm:1.40(9H,s),1.49-1		
		Boc N NHZ			
	88		黒褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:0.96(6H,t,J=7.5H z),3:06(4H,q,J=7.5Hz),5:15(2H,s),6:95( 1H,t,J=9Hz),7.12(1H,dd,J=9,2Hz),7.25 -7.45(6H,m),9.62(1H,br-s) IR ν(liq.) cm <sup>-1</sup> :1706 MS(m/z):316(M*) 赤褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:1.40(9H,s),1.49-1 .57(2H,m),1.82-1.88(2H,m),3.13-3.20( 2H,m),3:60-3:66(2H,m),4:35-4.41(1H,m ),5:14(2H,s),7:10-7:16(2H,m),7:30-7.4 4(6H,m),9:68(1H,br-s),		
	•	<b>F</b>			
			IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1668,3304		
			MS(m/z):444(M <sup>+</sup> )		

# 【0084】参考例89

N, N'ージーtert-ブトキシカルボニルー3ーフルオ ロー4ー (ピペラジンー1ーイル) アニリン 二炭酸ジーtert-ブチル5.56gのメタノール10ml 溶液に室温攪拌下、3-フルオロ-4-(ピペラジン-1-イル) アニリン2.00gのメタノール10ml溶液 を滴下して、室温で一晩攪拌した。析出した結晶を沪取 し、エタノールで洗浄して黄色結晶3-12gを得た。 酢酸エチルから再結晶して、融点194~195℃の淡 黄色結晶を得た。

元素分析值 C<sub>20</sub>H<sub>30</sub>FN<sub>3</sub>O<sub>4</sub>

理論値 C, 60.74; H, 7.65; N, 10.63

実験値 C, 60.47; H, 7.93; N, 10.53

【0085】参考例89と同様にして参考例90から9 2の化合物を得た

[0086]

【表26】

参考例	The state of the s	物性[再結晶溶媒]
		褐色液体
<u>-</u> .		NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.45(9H,s),3.26(
	· · ·	3H,s), $3.44(2H,t,J=4.5Hz)$ , $3.52(2H,t,J=$
	MeO N-N-NHBac	4.5Hz),3.55-3.60(2H,m),4.00-4.10(2H,
90	·	m),4.35-4.40(1H,m),6.46(1H,t,J=8.5Hz)
		7.04(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.22(1H,dd,J=1
		5.2Hz),9.03(1H,br-s)
	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1724,3328	
		$MS(m/z):340(M^*)$
		淡褐色鱗片状晶[CH₃CN]
	Record Committee	mp,220~221℃
91	NAME OF THE PARTY	元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub>
	F	理論值 C,59.67;H,7.12;N,7.33
		実験値 C,59.45;H,7.24;N,7.37
		褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.45(9H,s),3.2 3H,s),3.44(2H,t,J=4.5Hz),3.52(2H,t, 4.5Hz),3.55-3.60(2H,m),4.00-4.10(2 m),4.35-4.40(1H,m),6.46(1H,t,J=8.5H,7.04(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.22(1H,dd,J-5.2Hz),9.03(1H,br-s) IR ν(liq.) cm⁻¹:1724,3328 MS(m/z):340(M¹)  淡褐色鱗片状晶[CH <sub>3</sub> CN] mp.220~221℃ 元素分析値 C₁9H <sub>27</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub> 理論値 C,59.45;H,7.24;N,7.37 無色針状晶[iso-PrOH] mp.177~180℃ 元素分析値 C₁9H <sub>21</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,69.49;H,6.45;N,8.53
	NUR .	· ·
92 .		
	<b>F</b>	
L.,		実験値 C,69.46;H,6.72;N,8.61

# 【0087】参考例93

(R)-5-ヒドロキシメチル-2-オキソー3- [4 ー(チオモルホリンー4ーイル)フェニル] オキサゾリ ジン こうしゃ

**Nーベンジルオキシカルボニルー4ー(チオモルホリン** 

ラン250ml溶液に、窒素気流中で1.63mol/L n-ブ チルリチウムn-ヘキサン溶液50mlを-78℃で攪拌し つつ滴下し、滴下後同温で1時間撹拌した。この混合液 に(R)-(-)-グリシジルブチレート11.5mlを 滴下し、滴下後同温で1時間攪拌後、室温で23時間攪 ー4ーイル)アニリン25、0gの無水テトラヒドロフ 詳した。この反応液に10%塩化アンモニウム水溶液2

50mlを加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を水。飽和食塩水で順次洗浄し、芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄し、灰褐色結晶18.8gを得た。酢酸エチルから再結晶し、融点1

26.5~127.5℃の無色結晶を得た。

元素分析值 C<sub>14</sub> H<sub>18</sub> N<sub>2</sub> O<sub>3</sub> S

理論値 C,57.12; H,6.16; N,9.52

実験値 C, 56.85; H, 6.13; N, 9.25 比旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>20</sup>-40.9° (c=0.1, DMSO) 【0088】参考例93と同様にして参考例94から1 30の化合物を得た。

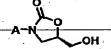
[0089]

【表27】

参考例	Α	物性[再結晶溶媒]
4-		淡紫色針状晶[EtOH]
•		mp,178~179℃
	N-(	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>17</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>
94		理論值 C,59.99;H,6.11;N,9.99
	F	実験値 C,59.97;H,6.06;N,9.98
	The second of th	比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -54.9° (c=0.1,DMSO)
		淡褐色結晶[AcOEt]
		mp,139.5~141°C
Δ.	MeO N	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
95		理論值 C,59.25;H,6.53;N,8.64
	F	実験値 C,58.95;H,6.46;N,8.39
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -43.1° (c=0.1,DMSO)
<del>`</del>		無色結晶[iso-PrOH]
		mp,131~132°C
· · · ·	FIO N	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
96		理論值 C,60.34;H,6.85;N,8.28
	f	実験值 C,60.20;H,7.07;N,8.11
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.1,DMSO)
		淡紫色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]
A via, i i i		mp,141.5~143°C
	Ma- N-	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>
97 :	\ \\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	理論值 C.62.32;H.6.86;N.9.09
	F.	実験值 C,62.21;H,6.94;N,9.01
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -42.9° (c=0.1,DMSO)
		無色針状晶[iso-PrOH]
		mp.149~149.5°C
·	Ft N	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>
98		理論值 C,63.34;H,7.19;N,8.69
	F F	実験値 C,63.17;H,7.35;N,8.67
		比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -43.0° (c=0.1.DMSO)
<del>                                     </del>	-	無色針状品[iso-PrOH]
		無世野 (A館[180-Pr01] mp,133.5~134.5℃
99	Bn N	元素分析值 C <sub>22</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>
	F F	理論值 C.68.73;H.6.55;N.7.29
		実験値 C,68.62;H,6.68;N,7.17
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -37.1° (c=0.1,DMSO)

[0090]

【表28】



	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]
•			無色結晶[AcOEt]
		MeQ	mp,94.5∼96℃
•	100		元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub>
	100	F <b>′</b>	理論值 C,58.68;H,6.84;N,7.60
		·	実験値 C,58.41;H,7.11;N,7.56
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -37.9° (c=0.1,DMSO)
			淡褐色プリズム状晶[AcOEt-iso-Pr,O]
•		~ _	mp,118~119°C
	101	N-(-)-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>
			理論值 C.62:32;H.6:86;N,9.09
<i>:1</i>		<b>F</b> .	実験値 C.62.13;H,6.98;N,9.07
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.9° (c=0.1,DMSO)
+ + - + - + - + - + - + - + - + - + - +			無色針状晶[AcOEt]
			mp,113~114°C
•••	102	MeO~~o~~N~~~~	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub>
	102	ت حر	理論值 C,56.46;H,6.22;N,8.23
			実験値 C,56.30;H,6.33;N,8.24
			比旋光度 [-α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -41.2° (c=0.1.DMSO)
•		·	無色プリズム状晶[iso-PrOH]
			mp,150~151°C
	103	MeN N-	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>
	100		<del>理論值 C.58:24;H.6:52;N,13:58</del>
•	:		実験値 C,58.33;H,6.31;N,13.56
			比旋光度 [α-] <sub>p</sub> 20=38.9° (c=0.1,DMSO)
_		·	淡褐色結晶[iso-PrOH]
•			mp.130~132°C
·	104	Bock N-	元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>5</sub>
	'		理論值 C,57.71;H,6.63;N,10.63
			実験値 C,57.55;H,6.87;N,10.57
		<u> </u>	比旋光度 [α] <sub>p</sub> ²º-36.0° (c=0.1,DMSO)

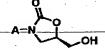
[0091]

【表29】

	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	
			淡褐色結晶	:
-			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.01(3H,t,J=7.5Hz	
			),1.76(2H,sex,J=7.5Hz),2.95(4H,t,J=5H	
			z),3.53-3.59(1H,m),3.62-3.68(1H,m),3.	
		<u> </u>	72(4H,t,J=5Hz),3.79(1H,dd,J=9,6.5Hz),	
	105	q N-{-}}-	3.93(2H,t,J=7.5Hz),4.03(1H,t,J=9Hz),4	
	100	n-Pro	.61-4.68(1H,m),5.07(1H,t,J=5.5Hz),6.8	
		11-10	7(1H,d,J=9Hz),6.93(1H,dd,J=9,2.5Hz),	
			7.29(1H,d,J=2.5Hz)	
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·				
••••			MS(m/z):336(M*)	
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -35.1° (c=0.1,DMSO)	
1 22			無色結晶	
			NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) δ ppm:2.96(4H,t,J=5H <sub>2</sub> ),	
	· ·· -··		3.33(3H,s),3.53-3.60(1H,m),3.62-3.70(	garage and the second
			1H.m),3.68(2H,t,J=5Hz),3.71(4H,t,J=5	
			Hz),3.80(1H,dd,J=9,6.5Hz),4.04(1H,t,J	
	106		=9Hz).4.09(2H.t,J=5Hz).4.61-4.68(1H,	·
	100	/-0	m),5.08(1H,t,J=5.5Hz),6.87(1H,d,J=8.5	
		MeO	Hz),6.98(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),7.28(1H,d,	
			J=2.5Hz)	
			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1744,3440	
			MS(m/z):352	
a yay mana		1	比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -36.0° (c=0.1,DMSO)	

[0092]

【表30】



. page 14 pt 1 + 1 (3.94) ; \*

参考例	A	物性[再結晶溶媒]
2 303		淡黄色結晶[EtOH]
	·	mp,127.5~128.5°C
		元素分析值 C <sub>11</sub> H <sub>13</sub> NO <sub>3</sub>
107	Me—(	理論值 C,63,76;H,6.32;N,6.76
		実験值 C,63.59;H,6.39;N,6.78
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -55.0° (c=0.1,DMSO)
		無色結晶
		NMR(DMSO-d <sub>B</sub> ) & ppm:1.17(3H,t,J=8Hz),
		2.58(2H,q,J=8Hz),3.50-3.60(1H,m),3.6
		2.36(2H, d, 3-8H2), 3.30-3.60(1H, m), 3.6
		05(1H,t,J=8.5Hz),4.60-4.70(1H,m),5.08
108	Et—( )—	(1H,t,J=5.5Hz),7.20(2H,d,J=8.5Hz),7.4
		6(2H.d.J=8.5Hz)
		IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1720.3480
		MS(m/z):221(M*)
• •		1
		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -44.9° (c=0.1,DMSO)
		無色結晶[AcOEt]
	·	mp.157~158.5°C
109	n-PrO-	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>4</sub>
	<u> </u>	理論值 C,62.14;H,6.82;N,5.57
		実験値 C,61.99;H,6.95;N,5.55
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -41.1° (c=0.1,DMSO)
		無色針状晶
		mp,144~145.5℃
110	MeO	元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>5</sub>
	MeO	理論值 C,56.91;H,5.97;N,5.53
		実験値 C,56.70;H,6.01;N,5.44
<u> </u>		比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -44.9° (c=0.1,DMSO)
		無色結晶[AcOEt]
		mp,140.5~142℃
111	л-Ви—	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> NO <sub>3</sub>
'''		理論值 C,67.45;H,7.68;N,5.62
		実験値 C,67.35;H,7.70;N,5.65
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -49.0° (c=0.1,DMSO)

[0093]

【表31】

_			*	•
	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	1
	•		無色プリズム状晶[EtOH]	1.
			mp,150~151℃	ı
١	112	Mo—()—	元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>3</sub>	
	112	سر	理論值 C,65.14;H,6.83;N,6.33	
		me	実験値 C,65.01;H,6.64;N,6.28	
4		<u></u>	比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -45.9° (c=0.1,DMSO)	L.
			無色プリズム状晶[iso-PrOH]	1
			mp,74.5~75℃	
1	113	F—《 ̄ <i>》</i> —	元素分析值 C <sub>10</sub> H <sub>2</sub> F <sub>2</sub> NO <sub>3</sub>	
1	1,3	<u> </u>	理論值 C,52.41;H,3.96;N,6.11	-
٠			実験値 C,52.34;H,3.98;N,6.14	-
- 1			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -51.1° (c=0.1,DMSO)	
			無色針状晶[iso-PrOH]	7
		alica, pullingularita	mp,121.5~123°C	
-	114	F.C./=\_	元素分析值 C <sub>11</sub> H <sub>10</sub> F <sub>3</sub> NO <sub>3</sub>	. 77.20
	117	300	理論值 C,50.58;H,3.86;N,5.36	
			実験値 C,50.58;H,3.71;N,5.37	
		0	比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -44.9° (c=0.1,DMSO)	
		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	無色針状晶[AcOEt-n-Hexane]	1
	-	· · ·	mp,93~94℃	
-	115		元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>4</sub>	1
	110		理論值 C,67.36;H,5.30;N,4.91	1
_			実験値 C,67.28;H,5.30;N,4.92	_
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -46.4° (c=0.4,MeOH)	
	. 0		淡橙色結晶[AoOEt]	
			mp,137~139℃	
	116		元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>13</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	
	,	N= }	理論值 C,59.21;H,4.31;N,9.21	1.
			実験値 C,59.08;H,4.48;N,9.05	1
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -39.9° (c=0.1,DMSO)	
	1	je	淡褐色針状晶[iso-PrOH]	
			mp,119~120℃	
	117	MeQ 0-	元素分析值 C13H18FNO5	
	]		理論值 C,54.73;H,5.65;N,4.91	1
			実験值 C.54.58;H.5.55;N,4.89	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.9° (c=0.1,DMSO)	

[0094]

【表32】

:	参考例	A	物性[再結晶溶媒]
·			無色プリズム状晶[AcOEt]
			mp,127~128℃
		M•2N O-	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>19</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
,	118	سر ک	理論值 C,56.37;H,6.42;N,9.39
·		<u>-</u>	<del>実験値 C,56.32;H,6.22;N,9.37</del>
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -42.2° (c=0.1,DMSO)
			淡黄褐色プリズム状晶[AcOEt]
			mp.80~81°C
	119	Me_N O	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
<del>~~</del>	119	<u> </u>	理論值 C,57.68;H,6.78;N,8.97
· )·			実験値 C,57.59;H,6.74;N,8.95
	-		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> 38.2° (c=0.1,DMSO)
		N-a-sudam	無色針状晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]
•			mp,66~66.5℃
	120	Me <sub>2</sub> N O	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>4</sub>
	120	وستري ا	理論值 C,58.88;H,7.10;N,8.58
		•	実験値 C,58.64;H,6.81;N,8.49
		•	比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-38.8° (c=0.1,DMSO)
			淡黄色柱状晶[iso-PrOH]
		м. ч	mp,11-1~112°C
•	121	N- N-	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>
	<del>                                     </del>		<del>理論值-C,57.86;H,7.12;N,13.5</del> 0
		*	実験値 C,57.96;H,7.12;N,13.40
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> 20-40.0° (c=0.1,DMSO)
•			黄褐色液体
•			NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:2.25(6H,s),2.51(2H,t,
		1	J=7.5Hz),2.97(2H,t,J=7.5Hz),3.76(1H,d
)		Ma.N.	d,J=12.5,4.5Hz),3.85-4.10(3H,m),4.70-
•	122	s-()	4.80(1H,m),7.20(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),7.
		F	41(1H,t,J=8.5Hz),7.47(1H,dd,J=11.5,2.
		ĺ	5Hz)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,3388
			MS(m/z):314(M <sup>+</sup> )
		1	比旋光度 [α] <sub>D</sub> 20-45.2° (c=0.1,DMSO)

[0095]

【表33】

	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]
	3 7 1/1		無色針状晶[CH <sub>2</sub> CN]
	4		mp,183~185°C
			mp,103~185 C   元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>16</sub> N₂O₃
	123	Me <sub>2</sub> N-	
	-	0.	理論值 C,61.00;H,6.83;N,11.86
	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		実験値 C,60.90;H,6.95;N,11.86
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -53.8° (c=0.1,DMSO)
•		·	無色プリズム状晶[AcOEt]
			mp.128~130℃
	124	Me <sub>2</sub> N-	元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>15</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>
·		F	理論值-C.56-69;H.5.95;N.11.02
			実験値 C,56.66;H,6.24;N,10.97
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -51.1° (c=0.1,DMSO)
			無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]
		Mq /	mp.95~96℃
	125	Et N	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>17</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub> ····································
		F	理論值 C,58.20;H,6.39;N,10.44
	i ·		実験値 C,58.06;H,6.53;N,10.36
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -54.8° (c=0.1,DMSO)
			褐色液体
			NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) & ppm:0.99(3H,t,J=7.5H
			z).3.11(2H.q.J=7.5Hz).3.56(1H.dd,J=12
- 770			.3.5Hz),3.66(1H,dd,J=12,3.5Hz),3.79(1
	1.26	Et <sub>2</sub> N-	H.dd,J=9,6.5Hz),4.04(1H,t,J=9Hz),4.60
	1.20		-4.70(1H.m),5.09(1H,br-s),7.03(1H,t,J
. *			=9Hz),7.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.44(1H,d d,J=15,2.5Hz)
	a		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1748,3416
			MS(m/z):282(M*)
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -39.2° (c=0.1,DMSO)
			ルル元及 [a] <sub>b</sub> ~-39.2 (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AcOEt]
			旅巴ノリスム状菌[AGUEt]   mp,145.5~146.5℃
			1 · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
	127		元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>3</sub>
			理論值 C,68.00;H,6.93;N,5.66
		· .	実験値 C,67.88;H,7.23;N,5.68
	L	1	比旋光度 [α] <sub>p</sub> 20-51.1° (c=0.1,DMSO)

[0096]

【表34】

参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	
	•	無色結晶[EtOH]	
		mp,109~110℃	
128	Boc-N -0-(-)	元素分析值 C₂₀H₂γFN₂O₅	
128	سر ب	理論值 C,58.53;H,6.63;N,6.83	
		実験値 C,58.28;H,6.54;N,6.83	
	<u> </u>	比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -32.0° (c=0.1,DMSO)	
理論値 C,58.53;H,6.63;N,6.83 実験値 C,58.28;H,6.54;N,6.83 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -32.0° (c=0.1,DMSC) 淡黄褐色プリズム状晶[AcOEt] mp.157~158℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>6</sub> 理論値 C,56.54;H,6.06;N,7.33 実験値 C,56.42;H,6.32;N,7.26 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -30.1° (c=0.1,DMSC)			
129		mp,157~158°C	
120	B∞-N →-O-(-)	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>6</sub>	
129	<u> </u>	理論值 C,56.54;H,6.06;N,7.33	
		実験值 C,56.42;H,6.32;N,7.26	
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -30.1° (c=0.1,DMSO)	
	無色結晶[EtOH] mp,109~110℃ 元素分析値 C₂₀H₂₂FN₂O₅ 理論値 C,58.53;H,6.63;N,6.83 実験値 C,58.28;H,6.54;N,6.83 比旋光度 [α]₀²⁰−32.0° (c=0.1,DMS 淡黄褐色プリズム状晶[AcOEt] mp,157~158℃ 元素分析値 C₁₀H₂₃FN₂O₀ 理論値 C,56.54;H,6.06;N,7.33 実験値 C,56.42;H,6.32;N,7.26 比旋光度 [α]₀²⁰−30.1° (c=0.1,DMS 淡褐色結晶[DMF] mp,243~245℃ 元素分析値 C₁₀H₁₂FN₂O₃ 理論値 C,65.84;H,5.22;N,8.53 実験値 C,65.72;H,5.10;N,8.67		
130		元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>17</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	
100		理論值 C,65.84;H,5.22;N,8.53	
		· ·	
	<u> </u>	比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-43.2° (c=0.1.DMSO)	

【0097】参考例131

(R) -5-メタンスルホニルオキシメチル-2-オキ ソ-3-[4-(チオモルホリン-4-イル)フェニ ルトオキサゾリジン

(R) -5-ヒドロキシメチルー2ーオキソー3ー [4 ー (チオモルホリンー4ーイル) フェニル] オキサゾリジン10.0gとトリエチルアミン10.5m1のジクロロメタン200m1溶液に氷冷攪拌下、メタンスルホニルクロリド3.20m1を滴下した後、室温で2時間攪拌した。反応液に水200m1を加えジクロロメタンで抽出した。抽出液を水,飽和食塩水で順次洗浄し、芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をジイソプロピルエーテ

ルで洗浄し、灰褐色結晶11.5gを得た。酢酸エチルから再結晶し、融点174.5~175.5℃の無色プリズム状晶を得た。

元素分析值 C<sub>15</sub> H<sub>20</sub> N<sub>2</sub>O<sub>5</sub> S<sub>2</sub>

理論値 C, 48.37; H, 5.41; N, 7.52

実験値 C, 48.41; H, 5.33; N, 7.36

比旋光度  $[\alpha]_{D}^{20}-54.2^{\circ}$  (c=0.1, DMSO)

【0098】参考例131と同様にして参考例132から170の化合物を得た。

[0099]

【表35】

***	参考例	19 A	物性[再結晶溶媒]
			無色結晶[AcOEt-iso-Pr,O]
·			mp,111~112℃
•			元素分析值 C₁₅H₁₅FN₂O₅S
	132		理論值 C,50.27;H,5.34;N,7.82
		F	実験値 C,50.10;H,5.30;N,7.73
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -50.1° (c=0.1,DMSO)
			無色プリズム状晶[AcOEt]
		<u> </u>	mp,124.5~125.5℃
		MeO N	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>6</sub> S
	133		理論值-C,50.74;H,5.76;N,6.96
The state of the s		F	実験值 C,50.50;H,5.66;N,6.87
*.			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -49.9°(c=0.1,DMSO)
		10 -	無色針状晶[iso-PrOH]
	1		mp,128~128.5°C
		EtO—N—	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>6</sub> S
	134		理論值 C,51.91;H,6.05;N,6.73
	*		実験値 C,51.80;H,6.29;N,6.69
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -47.9° (c=0.1,DMSO)
	<del></del>		淡紫色プリズム状晶[iso-PrOH]
·			mp,155~156.5℃
	105	Me—\ N—\ \	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub> S
and according to the second se	135		理論值 C.52.84;H.6.00;N.7.25
·.		-	実験値 C,52.65;H,6.22;N,7.07
	.1		比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -52.9° (c=0.1,DMSO)
	-		無色板状晶[EtOH]
			mp,155~156℃
	136	Et-( )+-( )-	一元素分析值 CiaH₂sFN₂OsS
	136		理論值 C,53.99;H,6.29;N,7.00
	ł		実験値 C,53.74;H,6.40;N,6.87
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -51.1° (c=0.1,DMSO)
· · · · · · ·	,		無色針状晶[iso-PrOH]
<i>i</i> * .			mp.131~132℃
	137	Bn-⟨ N-⟨ )-	元素分析值 C <sub>29</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub> S
	13,		理論值 C,59.72;H,5.88;N,6.06
		'	実験值 C,59.74;H,5.79;N,6.04
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -39.9° (c=0.1,DMSO)

[0100]

【表36】

· [	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	
			淡褐色針状晶[AcOEt]	
		MoO	mp.124~124.5°C	ı
	138	\ \ \\_\\_\\_\\_\\_\\_\\_\\	元素分析值 C <sub>10</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>7</sub> S	ı
	136	₽ <sup>'</sup>	理論値 C,51.11;H,6.10;N,6.27	
, • •			実験値 C,50.82;H,6.34;N,6.25	
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> =47.8° (c=0.1,DMSO)	┝
			無色針状晶[AcOEt-iso-Pr₂O]	ı
			mp,121~122.5℃	
	139	N-(=)	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub> S	Ŀ
•	139		理論值 C.52.84;H.6.00;N,7.25	
			実験値 C,52.57;H,6.16;N,7.20	ľ
- '	•		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -52.8° (c=0.1,DMSO)	
			褐色液体	١.,
		art is a second to	NMR(DMSO-d <sub>θ</sub> ) δ ppm:3.22(3H,s),3.26(3	
			H,s),3.45(2H,t,J=5Hz),3.53(2H,t,J=5Hz	ŀ
			),3.60-3.70(2H,m),3.77(1H,dd,J=9.5,6.	
•		MeO N	5Hz),4.10-4.15(3H,m),4.35-4.45(1H,m)	ŀ
	140.		.4.44(1H,dd,J=11.5,5.5Hz),4.49(1H,dd,	ľ
	140.	F	J=1-1-5,3Hz),4-90-5-00(1H,m).6-58(1H,t	-
		i.	,J=9Hz),7.12(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.37(1	١.
			H,dd,J=14.5,2.5Hz)	Ī
·	ļ	. (	IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754	ĺ
	<b>†</b>		MS(m/z):418(M*)	F
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -45.7° (c=0.1,DMSO)	
		LANCE OF THE PROPERTY OF THE P	無色プリズム状晶[AcOEt]	-
			mp.159.5~160.5℃	
	141	MeN	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S	
*		F	理論值 C,49.60;H,5.72;N,10.85	ı
. <del>1</del> 2			実験値 C,49.58;H,5.46;N,10.75	ı
•			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -49.0° (c=0.1,DMSO)	ı
•	į.		無色プリズム状晶[MeOH]	
			mp,182.5~183.5°C	
	142	Boch N-	元素分析值 CzoHzaFN <sub>2</sub> O <sub>7</sub> S	ĺ
		F	理論值 C,50.73;H,5.96;N,8.87	ĺ
	1		実験値 C,50.63;H,6.11;N,8.88	
	<u> </u>	<u> </u>	比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -46.0° (c=0.1,DMSO)	

[0101]

【表37】

参考例	Α	物性[再結晶溶媒]
		無色プリズム状晶[iso-PrOH]
		mp,100.5~101.5°C
140		元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>26</sub> N <sub>2</sub> O <sub>8</sub> S
143		理論值 C,50.22;H,6.09;N,6.51
	MeO-	実験値 C,50.12;H,6.00;N,6.39
		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -44.2° (c=0.1,DMSO)
		無色液体
		NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.01(3H,t,J=7.5H
		z),1.76(2H,sex,J=7.5Hz),2.96(4H,t,J=5
		Hz).3.23(3H,s),3.72(4H,t,J=5Hz),3.80(1
		H,dd,J=9,6.5Hz),3.93(2H,t,J=7.5Hz),4.
144	· ····································	15(1H,t,J=9Hz),4.44(1H,dd,J=11.5,5Hz
La Lar		),4.50(1H,dd,J=11.5,3Hz),4.93-5.00(1H
	ii-rio	m),6.88(1H,d,J=8.5Hz),6.93(1H,dd,J=8
		.5,2.5Hz),7.27(1H,d,J=2.5Hz)
	:	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754
		MS(m/z):414(M <sup>+</sup> )
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -41.9° (c=0.1,DMSO)
·		淡褐色結晶[iso-PrOH]
		mp,128~130°C
145	Na	元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>5</sub> S
173		理論值 C.50.52;H,5.30;N,4.91
-		実験値 C,50.23;H,5.30;N,4.83
		比旋光度[α] <sub>D</sub> 20-54.0° (c=0.1,DMSO)
-		淡褐色液体
Į		NMR(DMSO-d <sub>s</sub> ) δ ppm:2.32(3H,s),3.23(3
		H,s),3.83(1H,dd,J=9,6Hz),4.18(1H,t,J=
ľ.		9Hz),4.45(1H,dd,J=11.5,5.5Hz),4.51(1H
146		,dd,J=11.5,3Hz),4.96-5.01(1H,m),6.96(
	140	1H,d,J=7.5Hz),7.27(1H,t,J=7.5Hz),7.30
		-7.40(2H,m)
<b>.</b>		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754
		MS(m/z):285(M <sup>+</sup> )
· L	<u> </u>	比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -55.8* (c=0.1,DMSO)

[0102]

【表38】

بالإ	•
A=N_	OMs

	参考例	ranga daga karala 🗎 🗛 🔒 🔒 🖫	物性[再結晶溶媒]
	,	·	淡黄色プリズム状晶[iso-PrOH]
•			mp,113~113.5℃
	147	Me—()	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>5</sub> S
	147		理論値 C,52.16;H,5.72;N,4.68
		MC	実験値 C.51.91;H,5.56;N,4.63
			比旋光度[α] <sub>0</sub> 20-52.9° (c=0.1,DMSO)
(			無色結晶[iso-PrOH]
		٠.	mp,86.5∼88.5℃
	148	E	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>5</sub> S
	140	2.	理論值 C,52.16;H,5.72;N,4.68
			実験値 C,52.07;H,5.93;N,4.69
			比旋光度[α] <sub>p</sub> 20-59.1°(c=0.1,DMSO)
San manaman ang apap agam na paga tan ag			無色結晶[MeOH]
and the transmitted		1	mp,109~110.5℃
	149	n-Bu-	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>21</sub> NO <sub>5</sub> S
	, 43	"	理論值 C,55.03;H,6.47;N,4.28
			実験値 C,54.86;H,6.25;N,4.36
			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -52.9°(c=0.1,DMSO)
	l		褐色結晶
			NMR(DMSO-d <sub>e</sub> )δ ppm:3.23(3H,s),3.84(1
			H,dd,J=9,6.5Hz),4.19(1H,t,J=9Hz),4.46
			(1H,dd,J=11.5,5.5Hz),4.50(1H,dd,J=11.
	150	F-(	5,3Hz),4.95-5.05(1H,m),7.30-7.35(1H,
		<b>-</b>	m),7.45(1H,dd,J=20.5,9Hz),7.65-7.75(1
Day .			<b>然中(前)</b>
	·		IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732
•			MS(m/z):307(M*)
•	<b></b>		比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> –55.7° (c=0.1,DMSO)
			無色針状晶[iso-PrOH]
•			mp,103~105°C
	151	F <sub>3</sub> C-()_	元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>12</sub> F <sub>2</sub> NO <sub>5</sub> S
,	1.	<b>\</b>	理論値 C.42.48;H,3.56;N,4.13
			実験値 C,42.41;H,3.43;N,4.03
	L	<u> </u>	比旋光度[α] <sub>p</sub> 20-55.1°(c=0.1,DMSO)

[0103]

【表39】

	参考例	A **	物性[再結晶溶媒]
		* * * * * * * * * * * * * * * * * * * *	無色鱗片状晶[MeOH]
•			mp,149~150℃
			元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>8</sub> S
•	152	MeO-	理論值 C.47.83;H.5.02;N,4.65
			実験値 C,48.02;H,4.95;N,4.72
·			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -57.5° (c=0.5,DMSO)
·			無色針状晶[iso-PrOH]
		<i>*</i> , , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	mp,85.5~87.5°C
	150		元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> NO <sub>8</sub> S
	153	n-1-70-	理論值 C,51.05;H,5.81;N,4.25
			実験値-C,50.77;H,5.93;N,4.30
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -48.9° (c=0.1,DMSO)
			無色針状晶[AcOEt]
		and the second second	mp,137~139°C
	154	MeO-(	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>7</sub> S
	134	14-0	理論值 C.47.12;H.5.17;N,4.23
•	ļ.	meo	実験値 C.46.98;H,5.32;N,4.12、
•	·		比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -52.1° (c=0.1.DMSO)
	ļ		淡褐色鱗片状晶[AcOEt]
•			mp,106~107℃
	155		元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>17</sub> NO <sub>6</sub> S
			理論值 C,56.19;H,4.72;N,3.85
	<u> </u>		実験値 C,55.97;H,4.72;N,3.84
			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -59.3° (c=0.5,MeOH)
of the contract of the contrac			無色板状晶[EtOH]
			mp,120~121℃
•	156		元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>15</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>6</sub> S
		F	理論值 C,50.26;H,3.95;N,7.33
		4	実験值 C,50.24;H,3.93;N,7.27
			比旋光度[α] <sub>p</sub> 20-51.1° (c=0.1,DMSO)
***			無色結晶[EtOH]
			mp.72.5~74℃
	157	MeO	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FNO <sub>7</sub> S
•		F	理論值 C,46.28;H,4.99;N,3.85
•		1	実験値 C,46.22;H,4.95;N,3.83
	L	L	比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -51.2° (c=0.1,DMSO)

[0104]

【表40】

	参考例	A	物性[再結晶溶媒]
			無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]
•		<u> </u>	mp,61.5~62.5°C
	450	Mean p-	元素分析值 C, <sub>5</sub> H <sub>2</sub> ,FN <sub>2</sub> O <sub>6</sub> S-1/4H <sub>2</sub> O
	158		理論值 C,47.30;H,5.69;N,7.35
		, <b>F</b>	実験値 C,47.00;H,5.44;N,7.20
*	-		比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> =45.9° (c=0.1,DMSO)
		·	黄褐色液体
			NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:1.84(2H,quin,J=6.
		•	5Hz),2.15(6H,s),2.37(2H,t,J=6.5Hz),3.2
			3(3H,s),3.80(1H,dd,J=9,6Hz),4.06(2H,t,
		~ ^ \	J=6.5Hz),4.15(1H,t,J=9Hz),4.45(1H,dd,
• /	159	Me <sub>z</sub> N V	J=11.5.4.5Hz),4.51(1H,dd,J=11.5,3Hz),
	,	F	4.95-5.00(1H,m),7.15-7.24(2H,m),7.52
			(1H,dd,J=13.5,2.5Hž)
		, ,	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754
	1.	117 "	MS(m/z):390(M*)
•			比旋光度[α] <sub>p</sub> 20-48.9°(c=0.1,DMSO)
			淡黄褐色液体
	-  <u>·</u>		
		· .	7Hz),1.72(2H,quin,J=7Hz),2.12(6H,s),2
			.24(2H,t,J=7Hz),3.23(3H,s),3.80(1H,dd,
		Me <sub>2</sub> N	J=9,6Hz),4.04(2H,t,J=7Hz),4.15(1H,t,J
	160	<b></b>	=9Hz),4:45(1H,dd,J=11:5,5:5Hz),4:49(1
•		F	H.dd,J=11.5,3Hz),4.95-5.00(1H,m),7.1
			5-7.25(1H,m),7.31-7.38(1H,m),7.49-7.
٠.			54(1H,m)
		*	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1756
			比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -14.0° (c=0.1,DMSO)
)	1		淡黄色プリズム状晶[EtOH]
- -	[ · . ·	Mean /	mp,143~144.5°C
i wa	161	Me V	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S-HCl
	101	F F	理論值 C,45.12;H,5.92;N,9.87
		- HCI	実験値 C,44.99;H,5.88;N,9.72
	<u> </u>		比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -41.1°(c=0.1,DMSO)

[0105]

【表41】

	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	:
			橙色液体	
			NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:2.26(6H,s),2.52(2H,t,	
			J=7.5Hz),2.98(2H,t,J=7.5Hz),3.10(3H,s	
		: *	),3.95(1H,dd,J=9,6Hz),4.14(1H,t,J=9Hz	
			),4.43(1H,dd,J=11.5,4Hz),4.50(1H,dd,J	
	162	Mo <sub>2</sub> N S	=11.5,4Hz),4.90-5.00(1H,m),7.18(1H,d	
*		F <sup>'</sup>	d,J=8.5,2.5Hz),7.42(1H,t,J=8.5Hz),7.46	
•			(1H,dd,J=11.5,2.5Hz)	9
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1176,1358,1758,3432	
			MS(m/z):392(M*)	ta an in the same and the same of the same
***************************************			比旋光度[α] <sub>D</sub> 20-53.4° (c=0.1,DMSO)	
	,		無色ブリズム状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> 0]	
			mp,141.5~143℃	
The same of the sa	163	Ma.N	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>5</sub> S	e de la companie de la companie de la companie de la companie de la companie de la companie de la companie de La companie de la companie de la companie de la companie de la companie de la companie de la companie de la co
· . ·	,,,,		理論值 C,49.67;H,5.77;N,8.91	w.
		8	実験値 C,49.41;H,5.64;N,8.84	
			比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -55.9°(c=0.1,DMSO)	
	· ·		淡黄褐色無晶形固体	•
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:2.88(6H,s),3.23(3	
. •			H,s),3.82(1H,dd,J=9,6Hz),4.18(1H,t,J=	
	:	Ma.N	9Hz).4.45(1H,dd,J=11.5,5.5Hz),4.50(1H	
	164		.dd,J=11.5,3Hz),4.95-5.05(1H,m),7.20-	
	<u> </u>		7.30(2H,m),7.52(1H,d,J=14Hz)	
		1. 1.4	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1758	
and the same of th			MS(m/z):332(M <sup>+</sup> )	
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -41.5° (c=0.1,DMSO)	
•			淡紫色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	
		Me 🦱	mp,66~67℃	· .
* · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	165	_ <b>/-</b>	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>5</sub> S	
			理論值 C,48.55;H,5.53;N,8.09	
• •	1		実験値 C,48.20;H,5.64;N,7.94	
	L_		比旋光度[α] <sub>p</sub> 20-58.5° (c=0.1.DMSO)	

[0106]

【表42】

	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]
· i			褐色液体
			NMR(DMSO- $d_6$ ) $\delta$ ppm:1.00(6H,t,J=7Hz),
			3.15(4H,q,J=7Hz),3.23(3H,s),3.81(1H,d
			d,J=9,6Hz),4.16(1H,t,J=9Hz),4.45(1H,d
	450	ELN	d,J=11.5,5.5Hz),4.50(1H,dd,J=11.5,3H
	166	<u> </u>	z).4.95-5.05(1H,m),7.05-7.15(1H,m),7.
		•	15-7.25(1H,m),7.40-7.50(1H,m)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1178,1360,1756,
		·	MS(m/z):360(M <sup>+</sup> )
	–	.01	比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -42.2° (c=0.1,DMSO)
		and the same of th	無色針状晶[iso-PrOH]
			mp,100.5~102.5℃
·	167		元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>18</sub> NO <sub>5</sub> S
•	107		理論值 C,55.37;H,5.89;N,4.30
			実験値 C,55.11;H,6.02;N,4.27
			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -58.1°(c=0.1,DMSO)
			無色プリズム状晶[iso-PrOH]
	· .		mp,126~127.5℃
	168	Boc=N - >= 0 - \ - >	元素分析值_C21H29EN2O8S
•	100		理論值 C,51.63;H,5.98;N,5.73
		· · · · · · · · · · · · · · · · · ·	実験値 C,51.44;H,6.18;N,5.68——
		· .	比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.9° (c=0.1,DMSO)
	·/		無色プリズム状晶[iso-PrOH]
•			mp,114.5~117℃
• • •	169	Boc-N 0-(	元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>8</sub> S
•			理論值 C,49.56;H,5.47;N,6.08
٠.	i		実験値 C,49.46;H,5.67;N,6.03
•			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -46.0° (c=0.1,DMSO)
			淡褐色板状晶[CH₃CN]
:			mp,201~203℃
	170		一元素分析值 C₁₅H₁₅FN₂O₅S
. •			理論值 C,56.15;H,4.71;N,6.89
•	•		実験値 C,56.13;H,4.62;N,6.93
		1	比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -51.2" (c=0.1,DMSO)

### 【0107】参考例171

(R) -5-アジドメチル-2-オキソ-3-[4-(チオモルホリン-4-イル) フェニル] オキサゾリジ

(R) -5-メタンスルホニルオキシメチル-2-オキ ソー3-[4-(チオモルホリン-4-イル)フェニ ル] オキサゾリジン11.5gとアジ化ナトリウム8. 35gの無水N, N-ジメチルホルムアミド110ml懸 濁液を、65℃で5時間加熱攪拌した。冷後、反応液に 水200mlを加え酢酸エチルで抽出した。抽出液を水、 飽和食塩水で順次洗浄し、芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去

した。残渣をジイソプロピルエーテルで洗浄し、灰褐色 結晶8.85gを得た。酢酸エチルから再結晶し、融点 110~111℃の無色結晶を得た。

元素分析值 C<sub>14</sub> H<sub>17</sub> N<sub>5</sub> O<sub>2</sub> S

理論值 C,52.65; H,5.37; N,21.93

実験値 C,52.47; H,5.35; N,21.65

比旋光度  $[\alpha]_{D}^{20}-124.4$ ° (c=0.1, DMSO)

【0108】参考例171と同様にして参考例172か ら212の化合物を得た。

[0109]

【表43】

	参考例	A	物性[再結晶溶媒]	7
•	-12		無色結晶[AcOEt]	1
			mp,109~109.5℃	
	172	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	
	1/2	<u> حر</u> ح	理論值 C,55.08;H,5.28;N,22.94	
		<b></b>	実験値 C.54.88;H,5.12;N,22.70	İ
			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -136.4° (c=0.1,DMSO)	l
•			無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> 0]	1
			mp,89~90°C	
	172	MeO— N— —	元素分析值 C16H20FN5O2	
	173		理論值 C,55.01;H,5.77;N,20.05	ļ
			- 実験値 C,54.83;H,5.72;N,19.88-	<u> </u>
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -118.5° (c=0.1,DMSO)	
-			淡褐色針状晶[iso-PrOH]	
-		A STATE OF THE STA	mp.66~67℃	
	174	EtO-( )-( )-	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	
•	177		理論值 C.55.19;H,6.10;N,19.27	
•			実験値 C,56.05;H,6.36;N,19.23	-
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -110.5° (c=0.1.DMSO)	
			淡紫色プリズム状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	1
	i		mp,97.5~98.5℃	
	175	Me—( N—( )—	元素分析值 CieHzoFN5O2	ļ. <u>.</u>
			理論值 C,57.65;H,6.05;N,21.01	1
The second secon	4		実験値 C,57.69;H,6.21;N,20.90	
•	`		比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -122.4° (c=0.1.DMSO)	
	ľ	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	無色板状晶[EtOH]	l
			mp,99~100℃	
	176	Et—( )+—( )—	一元素分析值 C₁,H₂₂FN₅O₂	l
	'''		理論值 C,58.78;H,6.38;N,20.16	
	+	•	実験値 C,58.66;H,6.47;N,20.06	١.
			比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -117.3° (c=0.1,DMSO)	
			無色針状晶[MeOH]	
			mp,138.5~140.5°C	
	177	Bn-√ N-√ }	元素分析值 C <sub>22</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	
		ر کر ک	理論值 C,64.53;H,5.91;N,17.10	
		•	実験値 C,64.42;H,5.71;N,17.14	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -89.1° (c=0.1,DMSO)	

[0110]

【表44】

	N <sub>3</sub>			
	参考例	· / A	物性[再結晶溶媒]	1_
: <			淡褐色液体	1.
			NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:1.55-1.65(2H,m)	
	•		.1.90-2.00(2H,m).2.75-2.80(2H,m).3.	
			15-3.25(2H,m),3.27(3H,s),3.40-3.50(	ı
		W-0 - ( )	1H,m),3.45(2H,t,J=5Hz),3.56(2H,t,J=	l
:		m-c >-	5Hz),3.67(1H,dd,J=13.5,6Hz),3.70-3.	١.
	178		80(2H,m),4.10(1H,t,J=9Hz),4.80=4.90	ļ.,
			(1H,m),7.06(1H,t,J=9Hz),7.17(1H,dd,	
		·	J=9,2.5Hz),7.45(1H,dd,J=15,2.5Hz)	
			IR ν (lig.) cm <sup>-1</sup> :1756,2112	
•			MS(m/z):393(M*)	
. \ '			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -100.3° (c=0.1,DMSO)	-
) .			褐色液体	١.
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:3.26(3H,s),3.45(	
	4	And the second of the second o	2H.t.J=4.5Hz),3.53(2H,t,J=4.5Hz);3.6	
	Ì	A	0-3.75(5H,m),4.08(1H,t,J=9Hz),4.05-	
•		Meo O N N	4.15(2H,m),4.35-4.45(1H,m),4.80-4.9	
	179	* گر	0(1H,m),6.58(1H,t,J=8.5Hz),7.12(1H,	ı
			dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz	
		ļ		ļ-
i.		·	IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1752,2112	
		-	MS(m/z):365(M <sup>+</sup> )	-
:			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -91.4° (c=0.1,DMSO)	
			無色結晶[AcOEt−iso−Pr₂O]	-
•			mp,67~67.5℃	=
	180	N-(N-)	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	1
			理論值 C.57.65;H.6.05;N.21.01	ŀ
			実験値 C,57.66;H,6.09;N,21.05	
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -122.6° (c=0.1,DMSO)	ľ
			無色鱗片状晶[iso-PrOH]	
	1.		mp,106.5~107°C	Į.
	, 181	Man_N-	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>19</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>	
		<b> </b>	理論值 C,53.88;H,5.73;N,25.14	
			実験値 C,53.88;H,5.63;N,25.14	
	<u> </u>	1	比旋光度[α] <sub>p</sub> ²º-118.5° (c=0.1,DMSO)	Į.

· [0111] ...

【表45】

	参考例		di la Cora Ali di Sila di Ila
· .	\$ 45 171	Α	物性[再結晶溶媒]
			淡褐色針状晶[iso-PrOH]
			mp.112~113°C
•	182	Bock N-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>4</sub>
			理論值 C,54.28;H,5.99;N,19.99
		6	実験値 C,54.20;H,6.09;N,20.07
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -101.9° (c=0.1,DMSO)
	·		淡褐色針状晶[iso-PrOH]
:			mp,86.5~87℃
	100	d }~~~~	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub>
	1.83		理論值 C,56.50;H,6.41;N,19.38
		n-Po	実験値 C.56.70;H,6.57;N,19.41
	.,,		比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -108.6° (c=0.1,DMSO)
			褐色液体
		and the same of the same control of the same of the sa	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:2.96(4H,t,J=5Hz
÷		District Control of the Control of t	),3.33(3H,s),3.64-3.79(9H,m),4.08-4.
•			14(3H,m),4.82-4.88(1H,m),6.88(1H,d,
	184		J=8.5Hz),6.98(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),7.
4		W-0O	26(1H,d,J=2.5Hz)
		meo-	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,2112
			MS(m/z):377(M*)
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> 20-98.0° (c=0.1.DMSO)
•			赤褐色液体
			NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:2.33(3H,s),3.59(1H,
			dd,J=13.5,4.5Hz),3.68(1H,dd,J=13.5,
72			4.5Hz).3.84(1H,dd,J=9,6Hz),4,08(1H,
	185	Me—(	t,J=9Hz),4.74-4.80(1H,m),7.18(2H,d,
			J=8Hz),7.41(2H,d,J=8Hz)
	(A)		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,2112
			MS(m/z):232(M <sup>+</sup> )
.:			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -119.1° (c=0.1,DMSO)
141			無色結晶
• .	`\		NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:2.32(3H,s),3.68(
	,		1H,dd,J=13.5.6Hz),3.70-3.80(2H,m),4
r			.13(1H,t,J=9Hz).4.80-4.90(1H,m),6.9
	186		5(1H,d,J=8Hz),7.26(1H,t,J=8Hz),7.30
		Me	-7.40(2H,m)
		7-7	IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1736,2116
			MS(m/z):232(M*)
		·	比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -148.1° (c=0.1,DMSO)
	t		(0-0.1,DM30)

[0112]

【表46】



			, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
	参考例		物性[再結晶溶媒]	
•			淡褐色結晶[iso-Pr <sub>2</sub> O]	
			mp.85~85.5℃	
		Mo—(—)—	元素分析值 C.,H.,N.O,	
	187	<b>-</b>	理論值 C,58.53;H,5.73;N,22.75	
		Me	実験値 C,58.30;H,5.59;N,22.46	
			比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -140.4° (c=0.1,DMSO)-	
			淡黄色液体	•
	1	·	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) $\delta$ ppm:1.17(3H,t,J=8Hz	
			),2.59(2H,t,J=8Hz),3.67(1H,dd,J=13.	
			5,5.5Hz),3.70-3.80(2H,m),4.13(1H,t,J	
	188	Et—()	=9Hz),4.80-4.90(1H,m),7.22(2H,d,J=	
)	1		8.5Hz),7.45(2H,d,J=8.5Hz)	
	Į.		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1752,2112	•
		in the control of the	MS(m/z):246(M <sup>+</sup> )	
•			比旋光度[α] <sub>0</sub> 20-140.9°(c=0.1,DMSO)	1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1
			無色プリズム状晶[AcOEt-n-Hexane]	• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •
			mp,80~81℃	•
	400		元素分析值 C <sub>11</sub> H <sub>12</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>	
	189	MeO	理論值_C,53.22;H,4.87;N,22.57	
•			実験値 C,53.28;H,4.96;N,22.60	٠ .
			比旋光度[α] <sub>0</sub> 20-158.5°(c=0.5,MeOH)-	
			淡褐色液体	
			-NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:3.67(1H,dd,J=13-	<del></del>
			.5,6Hz),3.70-3.80(2H,m),3.74(3H,s),3	
			.76(3H,s),4.12(1H,t,J=9Hz),4.80-4.90	
	190	MeO	(1H,m),6.90-7.00(2H,m),7.30(1H,d,J=	
•		MeO	2.5Hz)	
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1750,2112	
· · · · )	ſ		MS(m/z):278(M <sup>+</sup> )	
•	·. ·		比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -113.5° (c=0.1,DMSO)	<u>.</u> :
<u>.</u> •		1.77		

; [0113]

【表47】

	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]
	1.00		淡黄色液体
			NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:0.97(3H,t,J=7.5H
i e	l., .		z).1.71(2H,sex,J=7.5Hz),3.66(1H,dd,J=
			13.5,5.5Hz),3.70-3.80(2H,m),3.91(2H,t,
•	•		J=7.5Hz),4.10(1H,t,J=9Hz),4.80-4.90(
	191	n-PrO-	1H.m).6.95(2H,d,J=9Hz).7.43(2H,d,J=9
			Hz)
			IR ν(liq.) cm <sup>-1</sup> :1756,2112
			MS(m/z):276(M*)
			上旋光度[α-] <sub>0</sub> 20−114.9°(c=0.1.DMSO)
	<u> </u>		<b>黄色液体</b>
Mark the companion of t			
	]		NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:0.89(3H,t,J=7.5H
			z).1.30(2H,sex,J=7.5Hz),1.54(2H,quin,
الله المواقع في الكليب المادا معكلات. والمستشرع المكافع والأوراء أفا معالي		- W. 11	J=7.5Hz):2-56(2H,t,J=7.5Hz),3.67(1H,d
	192	n-Bu—	d,J=13.5,6Hz),3.70-3.80(2H,m),4.13(1
			H,t,J=9Hz),4.80-4.90(1H,m),7.20(2H,d,
	*		J=8.5Hz),7.45(2H,d,J=8.5Hz)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,2112
			MS(m/z):274(M*)
			比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -132.6° (c=0.1,DMSO)
		للله المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة المنافعة	無色液体
		4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4	NMR(DMSO- $d_a$ ) $\delta$ ppm:3.68(1H,dd,J=13.
		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	5,5.5Hz),3.75(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),3.7
			8(1H,dd,J=9.5.5Hz),4.14(1H,t,J=9Hz),4
and the same of th	193		.80-4.90(1H,m),7.22(2H,t,J=9Hz),7.58(
			2H,dd,J=9,4Hz)-
	Ĭ .		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,2112
,	1	to the state of th	MS(m/z):236(M*)
	·		比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -127.3° (c=0.1,DMSO)
	ŀ	* · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	淡黄色液体
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	1	e de la companya de l	NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) δ ppm:3.70(1H,dd,J=14,
•			5.5Hz).3.75(1H,dd,J=14,3Hz),3.79(1H,d
		F	d,J=9,6Hz),4.14(1H,t,J=9Hz),4.85-4.95
	194	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	(1H,m),7.30-7.35(1H,m),7.45(1H,dd,J=
`		F F	20,9Hz),7.65-7.75(1H,m)
× .			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1760,2116
			MS(m/z):254(M <sup>+</sup> )
		<u></u> .	比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -128.8° (c=0.1,DMSO)
[0114]		• • •	

[0114]

【表48】

	参考例	el a la la la Alemana de la Cal	物性[再結晶溶媒]
		,	無色液体
•			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) $\delta$ ppm:3.69(1H,dd,J=13.
			5,5.5Hz),3.76(1H,dd,J=13.5,3.5Hz),3.7
•			8(1H,dd,J=9,6Hz),4.14(1H,t,J=9Hz),4.8
	195	cı—《 》	5-4.95(1H,m),7.44(2H,d,J=9Hz),7.58(2
	ļ	<u></u>	H,d,J=9Hz)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,2112
		·	MS(m/z):252(M*)
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -144.4° (c=0.1,DMSO)
			無色針状晶[iso-PrOH]
			mp,75.5~77℃
	196	F C-	元素分析值 C <sub>11</sub> H <sub>8</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>
	150	130	理論值 C,46.16;H,3.17;N,19.58
	i	and the second second	実験値 C.46.24;H,3.00;N,19:68
,	<u> </u>		比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -118.8° (c=0.1,DMSO)
	1		無色プリズム状晶[AcOEt-n-Hexane]
:		1	mp,90~91°C
	197		元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>14</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>
***************************************			理論值 C.61.93;H,4.55;N,18.06
			実験値 C.62.10;H.4.49;N.17.97
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -140.4° (c=0.5;MeOH)
			淡褐色液体
<del></del>	<del> </del>		NMR(CDCl₃) & ppm:3.61(1H,dd;J=13,4,5H
			z),3.75(1H,dd,J=13,4.5Hz),3.87(1H,dd,
••	-		J=8.5,6Hz),4.10(1H,t,J=8.5Hz),4.75=4.
:	198		85(1H,m),7.14(1H,t,J=9Hz),7.20-7.30(
		N	3H,m),7.63(1H,dd,J=12.5,3Hz),8.35(1H,
4.	1		d,J=3.5Hz),8.38(1H,d,J=2Hz)
)			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1756,2112
	1		MS(m/z):329(M <sup>+</sup> )
	:		比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -118.7° (c=0.1,DMSO)
	,		無色板状晶[EtOH]
•	1		mp,75~76℃
	199	MeO O	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>15</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>
	'33	-	理論值 C,50.32;H,4.87;N,18.06
			実験值 C,50.27;H,4.94;N,18.01
		<u>l.                                    </u>	比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -119.8° (c=0.1,DMSO)

[0115]

【表49】

	参考例	A	物性[再結晶溶媒]	_
			無色プリズム状晶[iso-Pr <sub>2</sub> 0]	i
		and the second second	mp.91~92℃	
	200	Me <sub>2</sub> N p	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>3</sub>	
	200	بحر ت	理論值 C,52.01;H,5.61;N,21.66	
	,		実験値 C,51.99;H,5.44;N,21.60	
			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -114.1°(c=0.1,DMSO)	
			淡黄褐色液体	•
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.84(2H,quin,J=6.	
•			5Hz),2.14(6H,s),2.35(2H,t,J=6.5Hz),3.6	
	, ,	-2	8(1H,dd,J=13.5,6Hz),3.70-3.80(2H,m),	
to the control of the	201	Me <sub>2</sub> N O	4.06(2H,t,J=6.5Hz),4.11(1H,t,J=9Hz),4-	
	201		.80-4.90(1H,m),7.15-7.21(2H,m),7.53(	:
		•	1H,dd,J=14,2Hz)	
		ونشارة في المعتقد ال	IR-v (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,2112	٠.
			MS(m/z):337(M <sup>+</sup> )	
:			比族光度 [α] <sub>p</sub> ²0-97.7°(c=0.1,DMSO)	
		·	淡褐色液体	•
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) $\delta$ ppm:1.53(2H,quin,J=	
			7Hz),1.72(2H,quin,J=7Hz),2.12(6H,s),2	:
•			.24(2H,t,J=7Hz),3.67(1H,dd,J=13.5,5.5	
		Me <sub>z</sub> N O	Hz),3.73(1H,dd,J=13.5,3Hz),3.75(1H,dd	
	202		.J=9,6Hz),4.04(2H,t,J=7Hz),4.11(1H,t,	
200 August 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	<u></u>	<u> </u>	J=9Hz),4.83-4.89(1H,m),7.15-7.21(2H,	<u></u>
•			m),7.52(1H,dd,J=13.5,2.5Hz)	
Vicinity (	:		IR <sub>-ν</sub> (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,2112	
			MS(m/z):351(M*)	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -88.6° (c=0.1,DMSO)	
			橙色液体	•
			NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:2.25(6H,s),2.48(2H,t,	
			J=7.5Hz),2.85(3H,s),3.23(2H,t,J=7.5Hz	
·	1,1.0	77 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7 7	),3.59(1H,dd,J=13.5,4.5Hz),3.69(1H,dd,	
	203	Mo <sup>2</sup> N V	J=13.5,4.5Hz),3.81(1H,dd,J=9,6Hz),4.0	
	203	Me July	4(1H,t,J=9Hz),4.70-4.80(1H,m),6.91(1	ı
·		r	H.t.J=9Hz),7.10(1H.dd,J=9,2.5Hz),7.37	
			(1H,dd,J=14.5,2.5Hz)	
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,2112	
		¥1	MS(m/z):336(M*)	•
_	L	1	比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -112.6° (c=0.1,DMSO)	

[0116]

【表50】

	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]
	וט כי עד		黄褐色液体
			NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:2.25(6H,s),2.52(2H,t,
			J=7.5Hz),2.98(2H,t,J=7.5Hz),3.60(1H,d
			d.J=13.4.5Hz),3.73(1H.dd.J=13.4.5Hz).
		Mo <sub>2</sub> N	3.85(1H,dd,J=9.6Hz),4.07(1H,t,J=9Hz),
	204	3-1	4.75-4.85(1H,m),7.20(1H,dd,J=8.5,2.5
• •	204	F	Hz),7.42(1H,t,J=8.5Hz),7.46(1H,dd,J=1
			1.5,2.5Hz)
		*	IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1756,2112
			MS(m/z):339(M*)
	2.1. 1114		比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -95.9° (c=0.1,DMSO)
)			無色プリズム状晶[AcOEt]
•		·	mp,112~113℃
•			元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>15</sub> N <sub>5</sub> O <sub>2</sub>
	205	Truesam in Me <sub>2</sub> N	理論值 C,55.16;H,5.79;N,26.80
	7		実験値 C,55.12;H,5.60;N,26.73
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -142.0° (c=0.1.DMSO)
			淡褐色結晶
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:2.75(6H,s),3.66(1
			H,dd,J=13.5,5.5Hz),3.70-3.75(2H,m),4.
			10(1H,t,J=9Hz),4.80-4.90(1H,m),6.98(
	206	Ma <sub>2</sub> N-	1H,t,J=9Hz),7.15(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.4
		F	3(1H,dd,J=15,2.5Hz)
•			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1752,2108
		المراجعة المستحدية	MS(m/z):279(M <sup>+</sup> )
			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -137.8° (c=0.1,DMSO)
	'.		褐色液体
			NMR(DMSO- $d_6$ ) $\delta$ ppm:1.03(3H,t,J=7Hz),
· ,		·	2.73(3H,s),3.12(2H,q,J=7Hz),3.67(1H,d
		We -	d,J=13.5,5.5Hz),3.70-3.80(2H,m),4.10(
	207	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	1H,t,J=9Hz),4.80-4.90(1H,m),6.98(1H,t
	20,	Et )—	,J=9Hz),7.16(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.42(1
	1.		H,dd,J=15.5,2.5Hz)
		0	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1756,2112
			MS(m/z):293(M*)
÷ .,	·		比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -134.8° (c=0.1,DMSO)

[0117]

【表51】

<del></del>	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	<u></u> -
	וטפיע		福色液体	
• • •			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:0.99(6H,t,J=7.5H	
			z),3.12(4H,q,J=7.5Hz),3.67(1H,dd,J=13	
	·			
•			.5,5.5Hz),3.70-3.80(2H,m),4.11(1H,t,J=	
	208	Et <sub>2</sub> N-	9Hz),4.80-4.90(1H,m),7.03(1H,t,J=9Hz	
			),7.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.42(1H,dd,J=	
		·	15.5,2.5Hz)	
	·	·	IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1756,2112	
			MS(m/z):307(M*)	
			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -105.8° (c=0.1,DMSO)	
**************************************			無色針状晶[iso=PrOH]	
•			mp,104~105.5°C	
• •	209		元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>16</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	
A Company of the Comp			理論值 C.61.75;H,5.92;N,20.58	-
ATT TO THE TOTAL OF THE TOTAL O	1		実験値 C,61.64;H,5.73;N,20.54	
		۲۰۰۰ کی جمع سینیون د	比旋光度[α] <sub>p</sub> ²º-135.9°(c=0.1,DMSO)	
	1		無色プリズム状晶[iso-PrOH]	٠
			mp.111~112.5℃	
•	210_	Boc-N >-0-	元素分析值 C₂₀H₂₅FN₅O₅	
	2.1.0		理論值 C,55.16;H,6.02;N,16.08	_
	ł		実験値 C,55.07;H,6.15;N,15.88	
			比旋光度[α] <sub>D</sub> 20-86.3° (c=0.1,DMSO)	٠.
-			無色プリズム状晶[iso-PrOH]	
,	1		mp,122~123℃	
American American	211	Bog-N O-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub>	
in the second	211		理論值 C,53.07;H,5.44;N,17.19	-,-
. •	]		実験値 C,53.02;H,5.66;N,17.22	
	Ì	المراجعين والمستود مداد والمردات	比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -96.8° (c=0.1,DMSO)	
• • •			無色針状晶[AcOEt]	
	Į.		mp,192~193℃	
	040	N-(-)	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>2</sub>	٠.
•	212		理論值 C,61.18;H,4.56;N,19.82	
	ŀ	F 1	実験値 C,61.01;H,4.46;N,19.43	•
*			比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -120.7°(c=0.1,DMSO)	
			1 (0, DMOO)	

## 【0118】参考例213

(R) -5-7ジドメチル-3-[3-7)ルオロ-4-(ピペラジン-1-4ル)フェニル]-2-7キソオキサゾリジン

(R) -5-アジドメチル-3-[4-(4-tert-ブトキシカルボニルピペラジン-1-イル) -3-フルオロフェニル] -2-オキソオキサゾリジン1.00gに、16%塩化水素酢酸エチル溶液20㎡を加えて室温で30分間攪拌し、析出した結晶を沪取した。結晶に水及び10%水酸化ナトリウム水溶液を加えてアルカリ性とした後、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水

で洗浄し、芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去し淡褐色結晶 0.72gを得た。イソプロパノールから再結晶して融 点114~115℃の無色結晶を得た。

元素分析值 C<sub>14</sub> H<sub>17</sub> F N<sub>6</sub> O<sub>2</sub>

理論値 C,52.49; H,5.35; N,26.24

実験値 C,52.24; H,5.21; N,26.15

比旋光度  $[\alpha]_{D}^{20}-127.3^{\circ}$  (c=0.1, DMSO)

【0119】参考例213と同様にして参考例214から215の化合物を得た。

[0120]

【表52】

	<u> Programme de la companya de la com</u>	
参考例	A	物性[再結晶溶媒]
		無色プリズム状晶[MeOH]
E		mp,169~170℃
	HNO	元素分析值 C15H18FN5O3・HCI
214	<b>F</b>	理論值 C,48.46;H,5.15;N,18.84
ŀ	- HCI	実験値 C,48.23;H,5.12;N,18.65
		比旋光度[α] <sub>p</sub> ²º-99.8° (c=0.1,DMSO)
-		<b>淡褐色結晶</b>
	•	NMR(DMSO- $d_6$ ) $\delta$ ppm:3.67(1H,dd,J=14,
	·	6Hz),3.70-3.80(2H,m),4.02(2H,dd,J=12
		.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.41(2H,dd,J=1
	HN -Q-(-)	2,7Hz),4.80-4.90(1H,m),5.05-5.15(1H,
215		m),7.05(1H,t,J=9Hz),7.22(1H,dd,J=9,2
	F - HCI	Hz),7.60(1H,dd,J=13.5,2Hz),9.46(1H,br
		-s)
		IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1744,2116
		MS(m/z):343(M*)
		比旋光度[α] <sub>p</sub> ²º-108.6° (c=0.1,DMSO)

【表53】。

## 【0121】参考例216

(R) -5-アジドメチル-3-[3-フルオロ-4-(ピペラジン-1-イル)フェニル] -2-オキソオキサゾリジン5.00gと炭酸カリウム2.16gの無水N,N-ジメチルホルムアミド溶液に、室温下ヨウ化エチル1.40mlを滴下し3時間室温攪拌した。反応液に水を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、芒硝乾燥後溶媒を減圧留去し、淡褐色結晶

4.53gを得た。酢酸エチルーn-ヘプタンの混液から 再結晶し、融点90~91℃の無色結晶を得た。 元素分析値 C<sub>16</sub>H<sub>21</sub>FN<sub>6</sub>O<sub>2</sub> 理論値 C,55.16; H,6.08; N,24.12 実験値 C,55.22; H,6.20; N,24.03 比旋光度 [α]<sub>p</sub><sup>20</sup> 120.9° (c=0.1, DMSO) 【0122】参考例216と同様にして参考例217か ら220の化合物を得た。 【0123】

	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]		
			淡褐色針状晶[iso-PrOH]		
			mp,113.5~114.5℃		
٠.	047	n-Pr-N N-	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>8</sub> O <sub>2</sub>		
	217		理論值 C,56.34;H,6.40;N,23.19		
	1		実験値 C,56.32;H,6.48;N,23.17		
		in the second of	比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -114.3°(c=0.1,DMSO)	-	•
			淡黄色鳞片状晶[iso=PrOH]		
			mp,102~103°C		
		n-Bu-N N-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>8</sub> O <sub>2</sub> - 1/8H,O	· ·	
	218		理論值 C,57.09;H,6.72;N,22.19		
		The later of the second of	実験値 C,57.10;H,6.86;N,22.20		
	2		比旋光度[α] <sub>p</sub> 20-104.8* (c=0.1.DMSO)		
	NI.		無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	·	
			mp,125~126.5℃		
	219	EKO2C N N-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>8</sub> O <sub>4</sub>	. 752. 1	
	213	حر ب	理論值 C,53.20;H,5.70;N,20.68		
	1		実験値 C,53.03;H,5.47;N,20.49		
			比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -101.5° (c=0.1,DMSO)		
			無色結晶[AcOEt−iso−Pr <sub>2</sub> O]		
	-1		mp.64.5∼66°C	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
	220	EtO,C N N	元素分析值 C <sub>20</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>4</sub>	: ÷	
			理論值 C,55.29;H,6.26;N,19-34		
			実験値 C,55.25;H,6.33;N,19.31		
<u> </u>	<u> </u>		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -89.0° (c=0.1,DMSO)	The second secon	
100				· .	

#### 【0124】参考例221

(R) -3-[4-[4-(5-アジドメチル-2-オ キソオキサゾリジン3-イル) -2-フルオロフェニ ル] ピペラジン-1-イル] プロピオン酸エチル

(R) -5-アジドメチル-3-[3-フルオロ-4-(ピペラジン-1-イル)フェニル] -2-オキソオキサゾリジン7.00gとアクリル酸エチル3.56mlのエタノール70ml溶液を1時間加熱還流した。溶媒を減圧留去し、カラムクロマトグラフィー(シリカゲル、ジエチルエーテル)で精製して、無色結晶7.50gを得た。イソプロパノールから再結晶して融点82~83℃の無色結晶を得た。

元素分析值 C<sub>19</sub> H<sub>25</sub> F N<sub>6</sub> O<sub>4</sub>

理論値 C,54.28; H,5.99; N,19.99

実験値 C,53.99; H,5.88; N,19.97

比旋光度  $[\alpha]_0^{20}-95.0^{\circ}$  (c=0.1, DMSO)

【0125】参考例222

(R) -5-アジドメチル-3-[3-フルオロ-4-

[4-(3-メトキシプロピオニル) ピペラジン-1-

イル]フェニル] -2-オキソオキサゾリジン

(R) -5-アジドメチル-3-[3-フルオロ-4-

(ピペラジン-1-イル)フェニル] -2 - オキソオキサゾリジン5.00gとトリエチルアミン3.26mlのテトラヒドロフラン50ml溶液に氷冷攪拌下、3-メトキシプロピオニルクロリド2.30gのテトラヒドロフラン10ml溶液を滴下した後、1時間氷冷攪拌した。反応液に水を加えて酢酸エチルで抽出した。抽出液を希塩酸,飽和炭酸水素ナトリウム水溶液及び飽和食塩水で順次洗浄し、芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去した。残渣をイソプロパノールージイソプロピルエーテルの混液で結晶化し、淡黄色結晶4.35gを得た。エタノールから再結晶して融点99~101℃の淡黄色プリズム状晶を得た。

元素分析值 C<sub>18</sub>H<sub>23</sub>FN<sub>6</sub>O<sub>4</sub>

理論値 C,53.20; H,5.70; N,20.68

実験値 C,53.07; H,5.68; N,20.75

比旋光度  $[\alpha]_{p^{20}}-106.9^{\circ}$  (c=0.1,DMSO)

【0126】参考例222と同様にして参考例223から226の化合物を得た。

[0127]

【表54】

参考例   A   物性[再結晶溶媒]   淡褐色プリズム 状晶[EtOH]   mp,105~106℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>19</sub> FN <sub>8</sub> O <sub>4</sub>   理論値 C,50.79;H,5.06;N,22.21   実験値 C,50.65;H,5.16;N,22.20   比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -103.9° (c=0.1,DMSO)   淡褐色プリズム 状晶[iso=PrOH]   mp,80~81.5℃   元素分析値 C <sub>1</sub> ,H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,51.91;H,5.12;N,17.80   実験値 C,51.91;H,4.87;N,17.75   比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -98.6° (c=0.1,DMSO)   淡黄色液体   NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ),6 ppm:1.50-1.70(2H,m), = 1.80=2.00(2H,m),2.57(2H,t,J=6Hz),3.20   -3.40(2H,m),3.23(3H,a),3.56(2H,t,J=6H z),3.20   -3.40(2H,m),3.67(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.7-27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,t,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,t,dd,J=13.5,5.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,t,dd,J=13.5,5.25(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.5,5.25(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=13.55(1H,t,dd,J=	<del></del>
凌褐色プリズム状晶[EtOH] mp,105~106℃ 元素分析値 C <sub>1e</sub> H <sub>1p</sub> FN <sub>e</sub> O <sub>4</sub> 理論値 C,50.79;H,5.06;N,22.21 実験値 C,50.66;H,5.16;N,22.20 比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -103.9° (c=0.1.DMSO)   凌褐色プリズム状晶[iso=PrOH] mp,80~81.5℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>2o</sub> FN <sub>8</sub> O <sub>5</sub> 理論値 C,51.91;H,5.12;N,17.80 実験値 C,51.91;H,4.87;N,17.75 比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -98.6° (c=0.1,DMSO)	
MeO <sub>2</sub> C-N N	
元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>19</sub> FN <sub>8</sub> O <sub>4</sub> 理論値 C,50.79;H,5.06;N,22.21 実験値 C,50.66;H,5.16;N,22.20 比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -103.9° (c=0.1,DMSO) 淡褐色プリズム状晶[iso=PrOH] mp,80~81.5℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>5</sub> 理論値 C,51.91;H,5.12;N,17.80 実験値 C,51.91;H,4.87;N,17.75 比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -98.6° (c=0.1,DMSO) 淡黄色液体 NMR(DMSO-d <sub>8</sub> )& ppm:1.50-1.70(2H,m), -1.80-2.00(2H,m),2.57(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m),3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m),3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6	
理論値 C,50.79;H,5.06;N,22.21 実験値 C,50.66;H,5.16;N,22.20 比旋光度[α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -103.9* (c=0.1,DMSO)	
実験値 C,50.66;H,5.16;N,22.20 比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -103.9° (c=0.1,DMSO)   透褐色プリズム状晶[iso=PrOH]   mp.80~81.5℃   元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>5</sub>   理論値 C,51.91;H,5.12;N,17.80   実験値 C,51.91;H,4.87;N,17.75   比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -98.6° (c=0.1,DMSO)   淡黄色液体   NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:1.50-1.70(2H,m),	
上旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -103.9° (c=0.1,DMSO)    淡褐色プリズム状晶[iso-PrOH]	
mp.80~81.5℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub> 理論値 C,51.91;H,5.12;N,17.80 実験値 C,51.91;H,4.87;N,17.75 比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -98.6° (c=0.1,DMSO) 淡黄色液体 NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.50-1.70(2H,m)1.80=2.00(2H,m).2.57(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6H z),3.65-3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H,m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,5.2.5Hz)	
元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub> 理論値 C,51.91;H,5.12;N,17.80 実験値 C,51.91;H,4.87;N,17.75 比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -98.6° (c=0.1,DMSO) 淡黄色液体 NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:1.50-1.70(2H,m), 1.80-2.00(2H,m),2.57(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6H z),3.65-3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H,m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5 Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,2.5Hz)   IR ψ (liq:) cm <sup>-1</sup> :1756,2112	
理論値 C,51.91;H,5.12;N,17.80 実験値 C,51.91;H,4.87;N,17.75 比旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -98.6° (c=0.1,DMSO) 淡黄色液体 NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:1.50-1.70(2H,m). 1.80-2.00(2H,m),2.57(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6Hz),3.565-3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H,m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,2.5Hz)  R ψ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1756,2112	
上旋光度[α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -98.6° (c=0.1,DMSO)  淡黄色液体 NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:1.50-1.70(2H,m), 1.80-2.00(2H,m),2.57(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6H z),3.65-3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5, 5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H,m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5 Hz),7-27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13-5,2.5Hz)	
次黄色液体 NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:1.50-1.70(2H,m).  1.80-2.00(2H,m).2.57(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6Hz),3.65-3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H,m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,2.5Hz)    R   \nu \( (\text{liq:}) \) cm <sup>-1</sup> :1756,2112	
NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) & ppm:1.50-1.70(2H,m).  1.80-2.00(2H,m),2.57(2H,t,J=6Hz),3.20 -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6Hz),3.65-3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H,m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,2.5Hz)    R-\nu(liq:) cm <sup>-1</sup> :1756,2112	
225  Meo  1.80=2.00(2H,m),2.57(2H,t,J=6Hz),3.20  -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6H  z),3.65=3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5, 5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H,  m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5  Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5, 5.2.5Hz)	
225  MeO  F  -3.40(2H,m).3.23(3H,s),3.56(2H,t,J=6H z),3.65-3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5, 5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H, m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5 Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5, 5,2.5Hz)	
z),3.65-3.85(4H,m),3.67(1H,dd,J=13.5, 5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H, m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9.2.5 Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5, 5,2.5Hz)	. : ::::
5.5Hz),4.12(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H, m),4.80-4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5 Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13-5,2.5Hz)	·
Meo'	
M∞0   F   m),4.80−4.90(1H,m),7.22(1H,dd,J=9,2.5   Hz),7.27(1H,t,J=9Hz),7.54(1H,dd,J=13.   5,2.5Hz)	
5,2.5Hz)	
	•
MS(m/z):421(M*)	<del></del> :
11 Abrata plants C. T. 20 - a an an an an an an an an an an an an a	
<u>比較光度</u> [α] <sub>2</sub> 20-86.2° (c=0.1,DMSO)	
淡褐色プリズム状晶[iso-PrOH]	
mp.82~83℃ 元素分析值 CHFN-Q-	
226 MeO <sub>2</sub> C-N O 元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>16</sub> FN <sub>5</sub> O <sub>5</sub> 理論值 C,49.32;H,4.41;N,19.17	
データ には 0.49.32;H,4.41;N,19.17 実験値 C,49.05;H,4.32;N,19.18	
失数值 0,49.05;H,4.32;N,19.18 比旋光度[α] <sub>p</sub> 20-103.9° (c=0.1,DMSO)	•
[ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [ [	

#### 【0128】参考例227

(S) -5-アミノメチル-2-オキソ-3-[4-(チオモルホリン-4-イル) フェニル] オキサゾリジ ン

(R) -5-アジドメチル-2-オキソ-3-[4-(チオモルホリン-4-イル)フェニル]オキサゾリジン8.50gとトリフェニルホスフィン7.68gの無水テトラヒドロフラン130ml溶液を、室温で15時間 攪拌した。この混合液に水4.8mlを加え40℃で14時間加熱攪拌した。冷後、反応液に水100mlを加え10%塩酸で酸性とした後、ジエチルエーテルで洗浄した。水層を炭酸カリウムでアルカリ性とした後、ジクロ

ロメタンーメタノール (30:1)の混液で抽出した。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去し、無色結晶6.88gを得た。酢酸エチルから再結晶し、融点119.5~121℃の無色結晶を得た。元素分析値  $C_{14}H_{19}N_3O_2S$  理論値 C,57.31; H,6.53; N,14.32 実験値 C,57.36; H,6.45; N,14.06 比旋光度  $[\alpha]_0^{20}-35.9$ ° (c=0.1, DMSO)【0129】参考例227と同様にして参考例228から278の化合物を得た。【0130】【表55】

No.	
	O .
A-N	ــــــــــــــــــــــــــــــــــــــ
	NH <sub>2</sub>

# 参考例 A 物性[再結晶溶媒]				NH2	
mp,100~101.5℃   元素分析値 C <sub>14</sub> H <sub>15</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,60.20;H,6.50;N,15.04   実験値 C,60.16;H,6.44;N,15.18   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>-0-3</sup> 8.9° (c=0.1,DMSO)   淡褐色結晶[iso=PrOH=iso=Pr <sub>2</sub> O]   mp,90~92℃   元素分析値 C <sub>15</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,61.46;H,6.56;N,14.40   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> =36.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[AcOEt-iso=Pr <sub>2</sub> O]   mp,102~102.5℃   元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,59.43;H,6.86;N,12.99   実験値 C,59.13;H,6.72;N,12.89   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO)   淡褐色結晶[iso=PrOH]   mp,85~86.5℃   元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,60.28;H,7.42;N,12.42   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[AcOEt-iso=Pr <sub>2</sub> O]   mp;111.5~113℃   元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,62.28;H,7.42;N,12.42   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[iso=PrOH]   mp,111.5~113℃   元素分析値 C,62.43;H,7.43;N,13.59   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO)   無色掛状晶[iso=PrOH]   mp,113~114℃   元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,62.52;H,7.53;N,13.07   実験値 C,63.52;H,7.53;N,13.07   実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97		参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	L
元素分析値 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C <sub>2</sub> 60.20;H,6.50;N,15.04 実験値 C <sub>2</sub> 60.16;H,6.44;N,15.18 比族光度 [α] <sub>2</sub> <sup>20</sup> -38.9° (c=0.1,DMSO)				無色結晶[AcOEt]	
理論値 C,60.20;H,6.50;N,15.04 実験値 C,60.16;H,6.44;N,15.18 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -38.9° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso=PrOH=iso=Pr <sub>2</sub> O] mp,90~92°C 元素分析値 C <sub>15</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,61.42;H,6.87;N,14.32 実験値 C,61.16;H,6.56;N,14.40 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO) 無色がよ晶[AcOEt-iso=Pr <sub>2</sub> O] mp,102~102.5°C 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,59.43;H,6.86;N,12.99 実験値 C,59.43;H,6.86;N,12.99 実験値 C,59.13;H,6.72;N,12.89 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso=PrOH] mp,85~86.5°C 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,60.52;H,7.17;N,12.45 実験値 C,60.52;H,7.17;N,12.45 実験値 C,62.43;H,7.42;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色抵状晶[iso=PrOH] mp,113~114°C 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97			<b>~ ~</b>	mp,100~101.5°C	
理論値 C,60.20;H,6.50;N,15.04 実験値 C,60.16;H,6.44;N,15.18 比族光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -38.9° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso=PrOH=iso=Pr <sub>2</sub> O] mp,90~92°C 元素分析値 C,1.42;H,6.87;N,14.32 実験値 C,61.42;H,6.87;N,14.32 実験値 C,61.42;H,6.87;N,14.40 北佐光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso=Pr <sub>2</sub> O] mp,102~102.5°C 元素分析値 C,1.61;H,6.72;N,12.89 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso=PrOH] mp,85~86.5°C 元素分析値 C,1.71;FN,12.45 実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比淀光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso=Pr <sub>2</sub> O] mp,11.5~113°C 元素分析値 C,1.61;FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.52;H,7.17;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso=PrOH] mp,113~114°C 元素分析値 C,1.71;4,4FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97	- :	228	[	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	
上旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -38.9° (c=0.1.DMSO)   淡褐色結晶[iso=PrOH=iso=Pr <sub>2</sub> O]   mp,90~92°   元素分析値 C <sub>15</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C <sub>61</sub> .42;H <sub>6</sub> .87;N,14.32   実験値 C <sub>61</sub> .16;H <sub>6</sub> .56;N,14.40   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1.DMSO)   無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,102~102.5°   元素分析値 C <sub>15</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C <sub>59</sub> .13;H <sub>6</sub> .72;N,12.89   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1.DMSO)   淡褐色結晶[iso-PrOH]   mp,85~86.5°   元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C <sub>60</sub> .52;H <sub>7</sub> .7.42;N,12.45   実験値 C <sub>60</sub> .28;H <sub>7</sub> .7.42;N,12.42   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1.DMSO)   無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp;11.5~113°   元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C <sub>62</sub> .43;H <sub>7</sub> .7.43;N,13.59   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1.DMSO)   無色抵状晶[iso-PrOH]   mp,113~114°   元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C <sub>63</sub> .52;H <sub>7</sub> .7.53;N,13.07   実験値 C <sub>63</sub> .53;H <sub>7</sub> .7.84;N,12.97		220		理論值 C,60.20;H,6.50;N,15.04	
				実験値 C,60.16;H,6.44;N,15.18	
			and service of the best of the service	比旋光度[α] <sub>p</sub> ²º-38.9°(c=0.1,DMSO)	
元素分析値 C <sub>15</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,61.42;H,6.87;N,14.32 実験値 C,61.42;H,6.86;N,14.40 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (σ=0,1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,102~102.5°C 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,59.13;H,6.72;N,12.89 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso-PrOH] mp,85~86.5°C 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,60.52;H,7.17;N,12.45 実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比掟光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp;111.5~113°C 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色抜状晶[iso-PrOH] mp,113~114°C 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97	· .			淡褐色結晶[iso=PrOH=iso=PrzO]	_
理論値 C,61.42;H,6.87;N,14.32 実験値 C,61.16;H,6.56;N,14.40 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (G=0:1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,102~102.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,59.43;H,6.86;N,12.99 実験値 C,59.13;H,6.72;N,12.89 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (G=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso-PrOH] mp,85~86.5℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,60.28;H,7.42;N,12.45 実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.45 実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (G=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,11.1.5~113℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (G=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.52;H,7.53;N,13.07				mp,90~92℃	
理論値 C,61.42;H,6.87;N,14.32 実験値 C,61.16;H,6.56;N,14.40 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,102~102.5°C 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,59.43;H,6.86;N,12.99 実験値 C,59.13;H,6.72;N,12.89 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso-PrOH] mp,85~86.5°C 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,60.52;H,7.17;N,12.45 実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>30</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113°C 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114°C 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.52;H,7.53;N,13.07		229	<b>⟨                                    </b>	元素分析值 C15H20FN2O2	-
上旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (G=0.1.DMSO)   無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,102~102.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,59.43;H,6.86;N,12.99   実験値 C,59.13;H,6.72;N,12.89   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (G=0.1,DMSO)   淡褐色結晶[iso-PrOH]   mp,85~86.5℃   元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,60.52;H,7.17;N,12.45   実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (G=0.1,DMSO)   無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,11.5~113℃   元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,62.43;H,7.43;N,13.59   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (G=0.1,DMSO)   無色抜状晶[iso-PrOH]   mp,113~114℃   元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07   実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97			ے کے ا	理論値 C,61.42;H,6.87;N,14.32	,
無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.102~102.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,59.43;H,6.86;N,12.99 実験値 C,59.13;H,6.72;N,12.89 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso-PrOH] mp.85~86.5℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,60.52;H,7.17;N,12.45 実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.111.5~113℃ 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp.113~114℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97					
mp,102~102.5℃   元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>				比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-36.1° (c=0.1,DMSO)	
元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,59,43;H,6.86;N,12.99 実験値 C,59,13;H,6.72;N,12.89 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso-PrOH] mp.85~86.5℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,60.52;H,7.17;N,12.45 実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.52;H,7.53;N,13.07				無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	
理論值 C,59.43;H,6.86;N,12.99 実験值 C,59.13;H,6.72;N,12.89 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso-PrOH] mp.85~86.5℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論值 C,60.52;H,7.17;N,12.45 实験值 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113℃ 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67 实験值 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 实験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97	:			- · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
理論值 C,59,43;H,6.86;N,12.99 実験值 C,59.13;H,6.72;N,12.89 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO) 淡褐色結晶[iso-PrOH] mp.85~86.5°C 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,60.52;H,7.17;N,12.45 实験值 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113°C 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67 实験值 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114°C 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 实験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97	٠.	230	MeO N		in dire
比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO)    淡褐色結晶[iso-PrOH]     mp,85~86.5℃     元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>     理論值 C,60.52;H,7.17;N,12.45     実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42     比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO)     無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]     mp,111.5~113℃     元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>     理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67     実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59     比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO)     無色板状晶[iso-PrOH]     mp,113~114℃     元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>     理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07     実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97	,				
浸褐色結晶[iso-PrOH]   mp.85~86.5℃   元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>   理論值 C,60.52;H,7.17;N,12.45   実験值 C,60.28;H,7.42;N,12.42   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,111.5~113℃   元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>   理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67   実験值 C,62.43;H,7.43;N,13.59   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO)   無色板状晶[iso-PrOH]   mp,113~114℃   元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>   理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07   実験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97	:				
Production   P					
元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,60.52;H,7.17;N,12.45 実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113°C 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114°C 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97			Ī		
理論值 C,60.52;H,7.17;N,12.45 実験值 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比淀光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113°C 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114°C 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97					<u>.</u>
実験値 C,60.28;H,7.42;N,12.42 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113℃ 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97		231	EtO-N-		
上旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -29.1° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113°C 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO)  無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114°C 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97			F		
無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,111.5~113℃ 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験值 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97	٠				
mp,111.5~113℃ 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験值 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO)  無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97					<del>; ;</del>
232					
理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67 実験值 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α]₀²⁰-35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析值 C₁,7H₂,4FN₃O₂ 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97				the same time that the same time to the same time to the same time to the same time to the same time to the same time to the same time to the same time time to the same time time time time time time time ti	- A
実験値 C,62.43;H,7.43;N,13.59 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO) 無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析値 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97	•	232			
比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -35.9° (c=0.1,DMSO)  無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 实験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97	٠.		<b>F</b>		
無色板状晶[iso-PrOH] mp,113~114℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97	٠.	Ì			
mp,113~114℃ 元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97					
元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97		ŀ			
理論值 C,63.52;H,7.53;N,13.07 実験值 C,63.34;H,7.84;N,12.97	· : -				i -, -
実験値 C,63.34;H,7.84;N,12.97	٠.	233			4.1
		2.0	<b>F</b>		
			1	此服元庆 [α] <sub>D</sub> ~~35.9 (c=0.1,DMSO)	

[0131]

【表56】

##				A-N_I	
無色結晶[iso-PrOH] mp,120.5~122℃ 元素分析値 (2-yH <sub>e</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 (2.68.91:H,5.83.N.10.96 実験値 (2.68.91:H,5.83.N.10.96 対象値 (2.68.93:H,6.80;N.10.99 比旋光度 [α] <sub>2</sub> <sup>30-2</sup> 8.9° (c=0.1,DMSO)	2 · 1 · · · · · · · · · · · · · · · · ·			NH <sub>2</sub>	
Bn		参考例-	A	物性[再結晶溶媒]	
元素分析値 C <sub>2</sub> H <sub>2</sub> <sub>6</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C <sub>6</sub> 8.9;H;H <sub>6</sub> 8.8iN,10.96 実験値 C <sub>6</sub> 8.9;H;H <sub>6</sub> 8.8iN,10.99 比旋光度 [a] <sub>3</sub> <sup>20</sup> -28.9° (c=0.1,DMSO) 波褐色柏高 NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.52(2H,br-s),1.5 5-1.65(2H,m),1.90-2.00(2H,m),2.70-2.85(3H,m).2.85(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.15 -3.25(2H,m),3.27(3H,s),3.40-3.50(1H,m),3.49(3H,t),1.50+1.2,3.56(2H,t,J=6,5Hz),3.40-3.50(1H,m),3.45(2H,t,J=9Hz),7 -1.7(H;dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz) IR ν(liq.) om <sup>-1</sup> :1744,3380 MS(m/z):367(M <sup>*</sup> ) 上旋光度 [a] <sub>3</sub> <sup>20</sup> -30.1° (c=0.1,DMSO)    大場色結晶 [A-GOE+]   mp,105 ~ 105.5°C   元素分析値 C <sub>1</sub> ;H <sub>16</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C <sub>5</sub> 56.94;H <sub>5</sub> 6.14(x),14.23   実験値 C <sub>5</sub> 56.94;H <sub>5</sub> 6.14(x),14.23   実験値 C <sub>5</sub> 56.94;H <sub>5</sub> 6.14(x),14.23   実験値 C <sub>5</sub> 56.94;H <sub>5</sub> 6.14(x),14.23   大場色結晶 [A-GOE+]   mp,105 ~ 105.5°C   元素分析値 C <sub>1</sub> ;H <sub>16</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C <sub>5</sub> 56.94;H <sub>5</sub> 6.14(x),14.23   大場値 C <sub>5</sub> 56.94;H <sub>5</sub> 6.14(x),14.23   大場値 C <sub>5</sub> 56.94;H <sub>5</sub> 6.91(x),3.98(1H,t,J=8.5Hz),3.55Hz),3.26(3H,a),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3.55(2Hz),3.55Hz),3.26(2H,m),3.7   (1H,dd,J=3.5,5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12   (1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12   (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz)   IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384   MS(m/z):339(M*)   比炭炭度 [a] <sub>1</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)				無色結晶[iso-PrOH]	
理論値 C.68.91;H.6.83;N,10.96 実験値 C.68.93;H.6.80;N,10.99 比旋光度 [ α ]。**-28.9* (c=0.1,DMSO)				mp,120.5~122°C	
理論値 C.68.91:H,6.83:N,10.96 来教値 C.68.93:H,6.80:N,10.99 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -28.9* (c=0.1,DMSO)	•	224	Bn—( N—( )—	元素分析值 C₂₂H₂₀FN₃O₂	
実験値 C,68.93:H,6.80:N,10.99   比接光度 [ \alpha ], 20~28.9" (c=0.1,DMSO)   淡褐色結晶   NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) & ppm:1.52(2H,br~s),1.5   5-1.65(2H,m),1.90~2.00(2H,m),2.70~2.85(3H,m),2.85(1H,d,J=13.5.5Hz),3.15   -3.25(2H,m),3.27(3H,s),3.40-3.50(1H,m),3.45(2H,t,J=5Hz),3.56(2H,t,J=5Hz),3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),4.01(1H,t,J=9Hz),4.55=4.65(1H,m),7.05(1H,t,J=9Hz),7   1.7(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)   IR \alpha (id), omn':1744,3380   MS(m/z):367(M')   比旋光度 [\alpha],20~30.1" (c=0.1,DMSO)   淡褐色結晶[\alpha C,56.94;H,6.14;N,14.23	•	234	سر ک	理論值 C,68.91;H,6.83;N,10.96	
液褐色結晶   NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) & ppm:1.52(2H,br-s),1.5   5-1.65(2H,m),1.90-2.00(2H,m),2.70-2   85(3H,m),2.85(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.15   -3.25(2H,m),3.27(3H,s),3.40(2H,t,J=5Hz),3.81(1H,dd,J=9.6.5Hz),4.01(1H,t,J=9Hz),7			F		
NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) & ppm:1.52(2H,br-s),1.5				比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -28.9° (c=0.1,DMSO)	
5-1.65(2H,m),1.90-2.00(2H,m),2.70-2.85(3H,m),2.85(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.15-3.25(2H,m),3.27(3H,s),3.40-3.50(1H,m),3.45(2H,t,J=5Hz),3.56(2H,t,J=5Hz),3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),0.1(1H,t,J=9Hz),7.2,4.55-4.65(1H,m),7.05(1H,t,J=9Hz),7.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)  R ッ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3380  MS(m/z):367(M*) 上座光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -30.1* (c=0.1,DMSO) 透褐色結晶(Ao Cet] mp.105~106,5°C 元素分析値 C,4H <sub>16</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,55.94:H,6.14:N,14.23 要較値 C,55.94:H,6.14:N,14.23 要較値 C,55.94:H,6.14:N,14.23 (C,56.96:H;5.92:N,14:00 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1* (c=0.1,DMSO) 福色液体 NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,t,J=8.5Hz),3.26(3H,t,J=8.5Hz),3.99(1H,t,J=8.5Hz),3.7 8(1H,dd,J=8.5,65Hz),3.99(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2 Hz) IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M*) 比変光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9* (c=0.1,DMSO)				淡褐色結晶	<del></del>
5-1.65(2H,m),1.90-2.00(2H,m),2.70-2.85(3H,m),2.85(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.15-3.25(2H,m),3.27(3H,s),3.40-3.50(1H,m),3.45(2H,t,J=5Hz),3.56(2H,t,J=5Hz),3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),0.1(1H,t,J=9Hz),7.2,4.55-4.65(1H,m),7.05(1H,t,J=9Hz),7.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)  R ッ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3380  MS(m/z):367(M*) 上座光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -30.1* (c=0.1,DMSO) 透褐色結晶(Ao Cet] mp.105~106,5°C 元素分析値 C,4H <sub>16</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,55.94:H,6.14:N,14.23 要較値 C,55.94:H,6.14:N,14.23 要較値 C,55.94:H,6.14:N,14.23 (C,56.96:H;5.92:N,14:00 比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1* (c=0.1,DMSO) 福色液体 NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,t,J=8.5Hz),3.26(3H,t,J=8.5Hz),3.99(1H,t,J=8.5Hz),3.7 8(1H,dd,J=8.5,65Hz),3.99(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2 Hz) IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M*) 比変光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9* (c=0.1,DMSO)			•	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.52(2H,br-s),1.5	
85(3H.m),2,85(1H,dd,J=13.5.5Hz),3.15   -3.25(2H,m),3.27(3H,s),3.40-3.50(1H,m),3.37(3H,s),3.40-3.50(1H,m),3.5(2H,t,J=5Hz),3.5(2H,t,J=5Hz),3.5(2H,t,J=5Hz),3.5(2H,t,J=9Hz),7   -3.25(2H,m),7.05(1H,t,J=9Hz),7   -1.7(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)   -1.7(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)   -1.7(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)   -1.7(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)   -1.7(1H,dd,J=16,5°C)   -1.7(1H,dd,J=16,5°C)   -1.7(1H,dd,J=16,4H,sFN,3O)   -1.7(1H,dd,J=16,4H,sFN,3O)   -1.7(1H,dd,J=16,4H,sFN,3O)   -1.7(1H,dd,J=16,4H,sFN,3O)   -1.7(1H,dd,J=13,5.5Hz),2.84(1H,dd,J=13,5.5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3.5(2H,t,J=4.5Hz),3.5(2H,t,J=4.5Hz),3.5(2H,t,J=4.5Hz),3.5(2H,t,J=4.5Hz),3.3(6O-3.65(2H,m),3.7   -1.7(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12   -1.7(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2   Hz)   -1.7(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2   Hz)   -1.7(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2   Hz)   -1.7(1H,dd,J=14.5,2   •		•			
MeO					
3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),4.01(1H,t,J=9Hz),7.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,d,J=9,17(1H,d,J=9Hz),7.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)  IR ν(liq.) cm⁻¹:1744,3380 MS(m/z):367(M²) 比旋光度 [α]₀²²-30.1² (c=0.1,DMSO) 液滑色結晶{-koet} mp,105~106.5℃ 元素分析値 C₁4H₁sFN₂O₂ 理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23 — 按键位 C,56.98;H,5.92;N,14.00 比旋光度 [α]₀²²-36.1² (c=0.1,DMSO) 褐色液体 NMR(DMSO-d₀) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=8,5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,6.5Hz),7.38(1H,d,J=14.5,2Hz) IR ν (liq.) cm⁻¹:1744,3384 MS(m/z):339(M²) 比旋光度 [α]₀²²-27.9° (c=0.1,DMSO)				-3.25(2H,m),3.27(3H,s),3.40-3.50(1H,	1
3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),4.01(1H,t,J=9Hz),7.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,d,J=9,17(1H,d,J=9Hz),7.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,2.5Hz)  IR ν(liq.) cm⁻¹:1744,3380 MS(m/z):367(M²) 比旋光度 [α]₀²²-30.1² (c=0.1,DMSO) 液滑色結晶{-koet} mp,105~106.5℃ 元素分析値 C₁4H₁sFN₂O₂ 理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23 — 按键位 C,56.98;H,5.92;N,14.00 比旋光度 [α]₀²²-36.1² (c=0.1,DMSO) 褐色液体 NMR(DMSO-d₀) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=4,5Hz),3.5(2H,t,J=8,5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,6.5Hz),7.38(1H,d,J=14.5,2Hz) IR ν (liq.) cm⁻¹:1744,3384 MS(m/z):339(M²) 比旋光度 [α]₀²²-27.9° (c=0.1,DMSO)	· \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \		MeO	m),3.45(2H,t,J=5Hz),3.56(2H,t,J=5Hz),	THE STREET OF TH
a		235			
R ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3380   MS(m/z):339(M*)   Liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3380   MS(m/z):339(M*)   上旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -30.1° (c=0.1,DMSO)   淡褐色結晶[AcOEt]   mp,105~106.5°C   元素分析値 C <sub>1,4</sub> H <sub>1,6</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C.56.68:H,5:92:N,14.00   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO)   褐色液体   NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7   9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3   5.5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3   5.5(2H,t,J=4.5Hz),3   5.5(2H,t,J=4.5Hz),3.45(2H,m),4.35-4.45(1H,m),4.50-4.60(1H,m),6.57(1H,t,J=8.5Hz),7.12   (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz)   IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384   MS(m/z):339(M*)   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)			<b>f</b>		, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,
R ν ( iq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3380   MS(m/z):367(M*)   比能光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -30.1° (c=0.1,DMSO)   淡褐色結晶[AcOEt]   mp.105~106.5℃   元素分析値 C <sub>14</sub> H <sub>16</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23	en en en la companya de la companya de la companya de la companya de la companya de la companya de la companya			.17(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.46(1H,dd,J=15,	. Strans of the strang of the strans of the strans of the strans of the strang of the
MS(m/z):367(M*) 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -30.1* (c=0.1,DMSO)	and the second of the second o			2.5Hz)	
上旋光度 [α] <sub>o</sub> <sup>20</sup> -30.1° (c=0.1,DMSO)   淡褐色結晶[AcOEt]   mp,105~106.5° 元素分析値 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23	• •			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3380	
			•	MS(m/z):367(M*)	
mp,105~106.5℃ 元素分析値 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23 - 実験値 C,56.68;H,5:92;N,14.00 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO) 褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) & ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3 .53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.7 8(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz)   IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384   MS(m/z):339(M¹)   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)				比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-30.1°(c=0.1,DMSO)	
元素分析値 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23 実験値 C,56.94;H,5.92;N,14.00 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO) 褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3 .53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.7 8(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2 Hz)    R ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384   MS(m/z):339(M*)   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)				淡褐色結晶[AcOEt]	
理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23 実験値 C,56.68;H,5:92;N,14:00 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO) 褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13. 5.5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3 .53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.7 8(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,6.5Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2 Hz) IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M*) 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)	}			mp,105~106.5℃	
理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23 - 実験値 C,56.68;H;5:92;N,14:00 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO) 褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) & ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13. 5.5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3 5.5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3 6(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2 Hz) IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M*) 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)		226	MeO-N-	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	
比較光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -36.1° (c=0.1,DMSO) 褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13. 5.5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3 .53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.7 8(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,t,J=8.5Hz),7.12(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz) IR ν(liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M <sup>*</sup> ) 比族光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)		230	) × ,>-/	理論値 C,56.94;H,6.14;N,14.23	
福色液体 NMR(DMSO-d <sub>0</sub> ) & ppm:1.54(2H,br~s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13. 5.5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3 5.53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.7 8(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2 Hz) IR ν(liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M*) 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)				実験値 C,58.68;H,5.92;N,14.00	
NMR(DMSO-d <sub>b</sub> ) & ppm:1.54(2H,br-s),2.7 9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3.53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.7 8(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),4.05-4.15(2H,m),4.35-4.45(1H,m),4.50-4.60(1H,m),6.57(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz) IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M*) 比旋光度 [ $\alpha$ ] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)		·		比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-36.1° (c=0.1,DMSO)	
9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3.53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.78(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),4.05-4.15(2H,m),4.35-4.45(1H,m),4.50-4.60(1H,m),6.57(1H,t,J=8.5Hz),7.12(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz)  IR ν(liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384  MS(m/z):339(M²)  比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)	***			褐色液体	er en en en en en en en en en en en en en
9(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.26(3H,s),3.45(2H,t,J=4.5Hz),3.53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.78(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),4.05-4.15(2H,m),4.35-4.45(1H,m),4.50-4.60(1H,m),6.57(1H,t,J=8.5Hz),7.12(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz)  IR ν(liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384  MS(m/z):339(M²)  比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)				NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.54(2H,br-s),2.7	
MeO					•
8(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),4.05-4.15(2H,m),4.35-4.45(1H,m),4.50-4.60(1H,m),6.57(1H,t,J=8.5Hz),7.12(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz)  IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384  MS(m/z):339(M <sup>+</sup> )  比旋光度 [ $\alpha$ ] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)					
8(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.98(1H,t,J=8.5Hz),4.05-4.15(2H,m),4.35-4.45(1H,m),4.50-4.60(1H,m),6.57(1H,t,J=8.5Hz),7.12(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2Hz)  IR $\nu$ (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384  MS(m/z):339(M <sup>+</sup> )  比旋光度 [ $\alpha$ ] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)				.53(2H,t,J=4.5Hz),3.60-3.65(2H,m),3.7	
50-4.60(1H,m),6.57(1H,t,J=8.5Hz),7.12 (1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2 Hz) IR ν(liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M <sup>+</sup> ) 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)		· .	MeO ~ O ~ N ~ ( ~ ) ~		
(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2 Hz) IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M <sup>*</sup> ) 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)		237		z),4.05-4.15(2H,m),4.35-4.45(1H,m),4.	
Hz) IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M <sup>+</sup> ) 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)			· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	50-4.60(1H,m),6.57(1H,t,J=8.5Hz),7.12	
Hz) IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384 MS(m/z):339(M <sup>+</sup> ) 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)				(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.38(1H,dd,J=14.5,2	
MS(m/z):339(M³) 比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9°(c=0.1,DMSO)	•	1.			
MS(m/z):339(M³) 比旋光度[α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9°(c=0.1,DMSO)	•			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1744,3384	
比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)		<u> </u>			•
【0132】 【表57】			·		
	[0132]				

Î.	
A-N N	HL

			NH <sub>2</sub>
	参考例	A	物性[再結晶溶媒]
			無色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]
·	:	_	mp,87~87.5℃
			元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub>
	238		理論值 C,62.52;H,7.21;N,13.67
	) •		実験値 C,62.23;H,7.28;N,13.51
		pro e e e e e e e e e e e e e e e e e e e	比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-44.0° (c=0.1.DMSO)
			無色結晶
		y	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.51(2H,br-s),2.8
			0(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.85(1H,dd,J=13.
			5.5Hz),2.96(4H,t,J=5Hz),3.33(3H,s),3.6
			8(2H,t,J=5Hz),3.71(4H,t,J=5Hz),3.81(1
	000	<u> </u>	H,dd,J=9,6:5Hz),4.02(1H,t,J=9Hz),4.09
	239		(2H,t,J=5Hz),4.52-4.60(1H,m),6.87(1H,
	4,000	MeO	d,J=8.5Hz),6.98(1H,dd,J=8.5,2.5Hz),7.
	- 3.	April - Sprace Carlon and Bernell accounts	27(1H,d,J=2.5Hz)
			IR v (KBr) cm <sup>-1</sup> :1748,3496
			MS(m/z):351(M <sup>+</sup> )
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -25.0°(c=0.1,DMSO)
			淡褐色結晶
• .		. :	$NMR(DMSO-d_6) \delta ppm:1.01(3H,t,J=7.5H)$
•			z),1.58(2H,br-s),1.76(2H,sex,J=7.5Hz),
			2.75-2.90(2H,m),2.95(4H,t,J=5Hz),3.72
			(4H,t,J=5Hz),3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),3.
	240		93(2H,t,J=7.5Hz),4.02(1H,t,J=9Hz),4.5
	1.54	n-PrO	3-4.60(1H,m),6.87(1H,d,J=9Hz),6.94(1
: .	4	L. Market development of the control	H,dd,J=9,2.5Hz),7.29(1H,d,J=2.5Hz)
	4		IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3388
			MS(m/z):335(M <sup>+</sup> )
•		and the second second	比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -28.0° (c=0.1,DMSO)
			<b>無色無晶形固体</b>
	.*		NMR(DMSO-d <sub>6</sub> )δ ppm:2.27(3H,s),2.80(1
			H,dd,J=13.5,5Hz),2.85(1H,dd,J=13.5,5
•			Hz),3.07(2H,br-s),3.82(1H,dd,J=8.5,6H
	241	Me—	z),4.02(1H,t,J=8.5Hz),4.53-4.61(1H,m)
			7.18(2H,d,J=8.5Hz),7.43(2H,d,J=8.5Hz
			) ×
			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1748,3356
	1	<b></b>	MS(m/z):206(M*)
	· L	<u> </u>	比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -38.1° (c=0.1,DMSO)
101221			7=E01

[0133]

【表58】

N-A	)
	NH <sub>2</sub>

				_
	参考例	A ( )	物性[再結晶溶媒]	Ī
		• .	無色液体	ĺ
			NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) δ ppm:1.52(2H,br-s),2.3	ĺ
	: :		1(3H,s),2.80(1H,dd,J=13.5,5.5Hz),2.86(	ļ
			1H,dd,J=13.5,5.5Hz),3.83(1H,dd,J=8.5,	ļ
		<del>\_</del> }_	6Hz),4.04(1H,t,J=8.5Hz),4.55-4.61(1H,	
·	242		m),6.93(1H,d,J=8Hz),7.25(1H,t,J=8Hz),	_
		Me	7.35-7.40(2H,m)	
		·	IR v (liq.) cm <sup>-1</sup> :1748,3392	
			MS(m/z):206(M*)	
	·		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -36.9° (c=0:1,DMSO)	
S			淡黄色結晶	
			NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:1.60(2H,br-s),2.1	
			9(3H,s),2.22(3H,s),2.80(1H,dd,J=13.5,5	
		and the recommendate of the sta	.5Hz).2.85(1H.dd.J=13.5,5.5Hz).3.81(1	
	in the state of	Me—	H,dd,J=9,6Hz),4.01(1H,t,J=9Hz),4.50-	
	243	<u></u>	4.60(1H,m),7.11(1H,d,J=8.5Hz),7.27(1	
	: "	Mé	H,dd,J=8.5,2.5Hz),7.32(1H,d,J=2.5Hz)	
			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1730,3420	
		Ĺ.	MS(m/z):220(M*)	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.1,DMSO)	
			無色結晶 · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
	-		NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) δ ppm:1.17(3H,t,J=7.5H	
	<u>.</u>		z),2.35(2H,br=s),2.58(2H,q,J=7.5Hz),2.	
	∴:	. 12.	81(1H.dd,J=13.5,5Hz),2.85(1H.dd,J=13	-
•. •	-244	E1-	.5,5Hz),3.83(1H,dd,J=9,5Hz),4:03(1H,t,	
- · · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	. '£		J=9Hz).4.55-4.65(1H,m),7.20(2H,d,J=8	
		, :	.5Hz),7.46(2H,d,J=8.5Hz)	
A second of			IR $\nu$ (KBr) cm <sup>-1</sup> :1730,3356	
<b>√</b>			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -38.1° (c=0.1,DMSO)	
			無色プリズム状晶[AcOEt-n-Hexane]	
	*		mp,80~81℃	
			元素分析值 C <sub>11</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	
,	245	MeO		
		÷	理論值 C,59.45;H,6.35;N,12.61	
, .	,	-	実験値 C.59.49;H,6.32;N,12.60	
			比旋光度[α] <sub>p</sub> ²º-59.0°(c=0.5,MeOH)	

[0134]

【表59】

Ĵ.		
A-N	) [	NU-
	$\sim$	NH <sub>2</sub>

				,*	
	参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	1	
			淡褐色液体	·	
•			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:2.80(2H,br-s),2.8		•
			1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.86(1H,dd,J=13.		
•		, . <u></u> .	5,5Hz),3.74(3H,s),3.76(3H,s),3.82(1H,d		
		MeO-(-)-	d,J=8.5,6.5Hz),4.03(1H,t,J=8.5Hz),4.55		
	246		-4.65(1H,m),6.90-7.00(2H,m),7.30-7.3		
		MeO	5(1H,m)		
			IR v (liq.) cm <sup>-1</sup> :1736,3436		
•	ŀ		MS(m/z):252(M <sup>+</sup> )		
			- 比旋光度 [α] <sub>p</sub> 20-38.2° (c=0.1,DMSO)		
			無色結晶		
		0.0	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:0.97(3H,t,J=7.5H		
			z),1.71(2H,sex,J=7.5Hz),2.80(1H,dd,J=		
En Januari			13.5,5Hz),2.85(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.10		72
<u> </u>			(2H,br-s),3.81(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),3.91		
······································	247	n-PrO	(2H,t,J=7.5Hz),4.01(1H,t,J=8.5Hz),4.5		·
			0-4.60(1H,m).6.94(2H,d,J=9Hz).7.44(2		
			H,d,J=9Hz)		
			IR v (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3336	· .	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.1,DMSO)	· .	
			無色結晶	1	
-	<b>.</b> .		NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) $\delta$ ppm:0.89(3H,t,J=7.5H		
		No. 1. 1. 1. 1. 1. 1. 1. 1. 1. 1. 1. 1. 1.	z),1.30(2H,sex,J=7.5Hz),1.54(2H,quin,		
			J=7.5Hz),2.55(2H,t,J=7.5Hz),2.80(1H,d		
			d,J=13.5,5Hz),2.85(1H,dd,J=13.5,5Hz),		:
	248	n-Bu-	3.13(2H,br-s),3.83(1H,dd,J=9,6.5Hz),4.		:
. 8			03(1H,t,J=9Hz),4.50-4.60(1H,m),7.18(		
<i>:</i>			2H,d,J=8.5Hz),7.45(2H,d,J=8.5Hz)		
•			IR v (KBr) cm <sup>-1</sup> :1748,3356		400
•	-		MS(m/z):248(M*)		الخنين أ
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -35.8° (c=0.1,DMSO)	,	
±	<del></del>		1971		

[0135]

【表60】

*** *** *** ** ** ** ** ** ** ** ** **			• • • • • • • • • • • • • • • • • • • •		_
NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) δ ppm:2.81(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.86(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.84(2H,br-s),3.85(1H,dd,J=8.5,5Hz),4.05(1H,t,J=8.5)+2,4.55-4.65(1H,m),7.21(2H,t,J=9Hz),7.55-7-60(2H,m)  IR ν(KBr) cm <sup>-1</sup> :1728,3328 MS(m/z):210(M*) 比淀光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.0* (c=0.1,DMSO) 無色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,47~49°C 元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,52.84;H,4.41;N,12.17 比淀光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -37.0* (c=0.5,MeOH) 淡褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) δ ppm:1.83(2H,br-s),2.8 1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=8.5Hz) IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z):226(M*) 比淀光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.5* (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,60~62°C 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比淀光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -33.0* (c=0.1,DMSO) 無色がりズム状晶[AoOEt] mp,110~111°C 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84		参考例	Α	物性[再結晶溶媒]	
5.5Hz).2.86(1H,dd,J=13.5,5Hz).2.84(2H,br-s).3.85(1H,dd,J=8.5,5Hz).4.05(1H,t).J=8.5Hz).4.55-4.65(1H,m).7.21(2H,t,J)=9Hz).7:55-7.60(2H,m) IR ν(KBr) cm <sup>-1</sup> :1728,3328 MS(m/z):210(M*) 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -40.0* (c=0.1,DMSO) 無色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.47~49°C 元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28 実験値 C,52.63;H,4.41;N,12.17 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -37.0* (c=0.5,MeOH) 淡褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) δ ppm:1.83(2H,br-s).2.8 1(1H,dd,J=13.5,5Hz).2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz).3.85(1H,dd,J=9,5Hz).4.05(1H,t,J=13.5,1Hz).2.87(1H,dd,J=13.5,1Hz).2.87(1Hz)				淡褐色結晶	
hr-s),3.85(1H,dd,J=8.5,5Hz),4.05(1H,t)	•		.•	NMR(DMSO-d <sub>6</sub> )δ ppm:2.81(1H,dd,J=13.	
(J=8.5Hz).4.55-4.65(1H,m).7.21(2H,t,J) =9Hz).7-55-7-60(2H,m)   R ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1728,3328   MS(m/z):210(M*)   比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -40.0* (c=0.1,DMSO)   無色結晶[AcOEtーiso-Pr <sub>2</sub> O]   mp.47~49°C   元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28   実験値 C,52.84;H,4.41;N,12.17   比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -37.0* (c=0.5,MeOH)   淡褐色液体   NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:1.83(2H,br-s),2.8   1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz)   IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332   MS(m/z):226(M*)   比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -40.5* (c=0.1,DMSO)   無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp.60~62°C   元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,50.76;H,4.14;N,10.73   比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -33.0* (c=0.1,DMSO)   無色ブリズム状晶[AoOEt]   mp.110~111°C   元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85   実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84			-	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
Section   Se				,br-s),3.85(1H,dd,J=8.5,5Hz),4.05(1H,t	
Section   Se		249	F—《 ̄》—	.J=8.5Hz),4.55-4.65(1H,m),7.21(2H,t,J	i
MS(m/z):210(M*) 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.0* (c=0.1,DMSO)   無色結晶 [AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,47~49℃   元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28   実験値 C,52.84;H,4.41;N,12.17   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.0* (c=0.5,MeOH)   淡褐色液体   NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) & ppm:1.83(2H,br-s),2.8   1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz)   IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332   MS(m/z):226(M*)   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5* (c=0.1,DMSO)   無色結晶 [iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,60~62℃   元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77   実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0* (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状晶 [AcOEt]   mp,110~111℃   元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85   実験値 C,67.51;H,5.69;N,9.84		· -			_
比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.0* (c=0.1,DMSO)   無色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,47~49°C   元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28   実験値 C,52.84;H,4.41;N,12.17   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.0* (c=0.5,MeOH)   淡褐色液体   NMR(DMSO-d <sub>8</sub> ) δ ppm:1.83(2H,br-s),2.8   1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz)   IR ν (KBr) em <sup>-1</sup> :1732,3332   MS(m/z);226(M*)   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5* (c=0.1,DMSO)   無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,60~62°C   元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77   実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0* (c=0.1,DMSO)   無色ブリズム状晶[AcOEt]   mp,110~111°C   元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85   実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	. ;			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1728,3328	
無色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,47~49℃ 元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28 実験値 C,52.84;H,4.41;N,12.17 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.5,MeOH) 淡褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) & ppm:1.83(2H,br-s),2.8 1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz) IR ν(KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z):226(M¹) 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比変光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84				MS(m/z):210(M*)	
mp,47~49°C   元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28   実験値 C,52.84;H,4.41;N,12.17   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.5,MeOH)   淡褐色液体   NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) & ppm:1.83(2H,br~s),2.8   1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9)+z),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz)   IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332   MS(m/z):226(M²)   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO)   無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,60~62°C   元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77   実験性 C,50.76;H,4.14;N,10.73   比定光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状路[AoOEt]   mp,110~111°C   元素分析値 C <sub>1e</sub> H <sub>1e</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85   実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84				比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -40.0° (c=0.1,DMSO)	
元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28 実験値 C,52.84;H,4.41;N,12.17 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.5,MeOH) 淡褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) & ppm:1.83(2H,br-s),2.8 1(1H,dd,J=13.5.5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5.5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz) IR ν(KBr) 'cm <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z):226(M*) 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.76;H,4.14:N,10.73 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色ブリズム状晶[AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>1e</sub> H <sub>1e</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84		. :		無色結晶[AcOEt-iso-PrzO]	
理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28 実験値 C,52.84;H,4.41;N,12.17 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.5,MeOH) 淡褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.83(2H,br-s),2.8 1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13. 5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t, J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz) IR ν(KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z):226(M*) 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.76;H,4.14:N,10.73 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>1e</sub> H <sub>1e</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	:	÷:		mp,47~49℃	
理論値 C,52.63;H,4.42;N,12.28   実験値 C,52.84;H,4.41;N,12.17   比定光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.5,MeOH)   淡褐色液体   NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) δ ppm:1.83(2H,br-s),2.8   1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz)   IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332   MS(m/z):226(M*)   比定光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO)   無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,60~62℃   元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77   実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73   比定光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状晶[AcOEt]   mp,110~111℃   元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85   実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84		250	<b>F</b> ─ <b>⟨ ⟩</b> ─	元素分析值 C <sub>10</sub> H <sub>10</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	
比較光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.5,MeOH)    淡褐色液体   NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) δ ppm:1.83(2H,br-s),2.8   1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz)   IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332   MS(m/z):226(M²)   比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO)   無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,60~62°C   元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77   実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73   比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状晶[AoOEt]   mp,110~111°C   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85   実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	•	230	<u> </u>	理論值 C,52.63;H,4.42;N,12.28	
淡褐色液体 NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.83(2H,br~s),2.8 1(1H,dd,J=13.5.5Hz),2.87(1H,dd,J=13. 5.5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t <sub>1</sub> J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz) IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z):226(M*) 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.5* (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -33.0* (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AoOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	:		Carlo in Committee and The Committee		: :
NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) & ppm:1.83(2H,br~s),2.8 1(1H,dd,J=13.5.5Hz),2.87(1H,dd,J=13. 5.5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t, J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz) IR ν(KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z):226(M*) 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AoOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84			٠.		
1(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.87(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,tr.J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz) IR ν (KBr) em <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z);226(M*) 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14:N,10.73 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AoOEt] mp.110~1111℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	•				ĺ
5,5Hz),3.85(1H,dd,J=9,5Hz),4.05(1H,t,J=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8.5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz) IR ν (KBr) em <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z):226(M*) 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色ブリズム状晶[AcOEt] mp.110~111℃ 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	•	·			
D=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.42(2H,d,J=8 .5Hz),7.59(2H,d,J=8.5Hz) IR ν (KBr) em <sup>-1</sup> :1732,3332 MS(m/z):226(M*) 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	٠.			1	
SHz),7.59(2H,d,J=8.5Hz)   IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3332   MS(m/z):226(M*)   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO)   無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,60~62℃   元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77   実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状晶[AcOEt]   mp,110~111℃   元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85   実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84			/-\		
IR ν (KBr) cm⁻¹:1732,3332  MS(m/z):226(M²)  比旋光度 [α] <sub>D</sub> ²⁰-40.5° (c=0.1,DMSO)  無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr₂O]  mp,60~62℃  元素分析値 C₁₁H₁₁F₃N₂O₂  理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77  実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73  比旋光度 [α] <sub>D</sub> ²⁰-33.0° (c=0.1,DMSO)  無色プリズム状晶[AcOEt]  mp,110~111℃  元素分析値 C₁₅H₁₅N₂O₃  理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85  実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84		251	ci—(		
MS(m/z):226(M*)   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO)   無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,60~62℃   元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>   理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77   実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73   比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状晶[AcOEt]   mp,110~111℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub>   理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85   実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84				1	
比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -40.5° (c=0.1,DMSO) 無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84		·		Į	
無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,60~62℃ 元素分析値 C <sub>11</sub> H <sub>11</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[A <sub>0</sub> OEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84		-			<del></del>
mp,60~62℃ 元素分析値 C₁₁H₁₁F₃N₂O₂ 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α]₀²⁰−33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AαOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C₁₅H₁₅N₂O₂ 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84			2019 99	**************************************	;
元素分析値 C₁₁H₁₁F₃N₂O₂ 理論値 C,50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α]₀²⁰−33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶 [AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C₁₅H₁₅N₂O₂ 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	-				₹.
理論値 C.50.77;H,4.26;N,10.77 実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> −33.0° (c=0.1,DMSO)  無色プリズム状晶[AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84				· ·	
実験値 C,50.76;H,4.14;N,10.73 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84	•	252	F <sub>3</sub> C-()		
比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> −33.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶 [AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84					•
無色プリズム状晶[AcOEt] mp,110~111℃ 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> 理論値 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84					
mp,110~111℃ 元素分析值 C₁₅H₁₅N₂O₃ 理論值 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験值 C,67.31;H,5.69;N,9.84	:				
元素分析值 C₁₅H₁₅N₂O₂ 理論值 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験值 C,67.31;H,5.69;N,9.84	٠.			1	
理論值 C,67.59;H,5.67;N,9.85 実験值 C,67.31;H,5.69;N,9.84	,			-	
実験値 C,67.31;H,5.69;N,9.84		253	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\		
			· .		
				此账元段、[α] <sub>D</sub> 51.5 (C=0.5,MeOH)	

[0136]

Ĭ,	~o	
A-N	<u> </u>	
	NH <sub>2</sub>	

NH <sub>2</sub>			_	
	参考例	A TOTAL	物性[再結晶溶媒]	
		1 - y 79 a 3y 1,2 2	淡黄色結晶[AcOEt-n-Hexane]	
			mp,78~79℃	
* 2	054		元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>14</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>3</sub>	
	254	`N=-/ _}_/	理論值 C,59.40;H,4.65;N,13.85	
·		F	実験値 C,59.35;H,4.73;N,13.77	
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -40.1° (c=0.1,DMSO)	
			淡黄色結晶	_
	<b>.</b>	, :	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) δ ppm:1.31(2H,br-s),2.98(1	
		,	H,dd,J=13.5,4.5Hz),3.11(1H,dd,J=13.5,	
	7,7		4.5Hz),3.45(3H,s),3.76(2H,t,J=4.5Hz),3	
			.82(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),4.00(1H,t,J=8.5	-
	255	MeO	Hz),4.18(2H,t,J=4.5Hz),4.60-4.70(1H,	
		F	m),7.00(1H,t,J=9Hz),7.10-7.20(1H,m),7	
· · · · ·		'	.47(1H,dd,J=13,3Hz)	
	عليد بلغ	and the second second	IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1746,3328,3396	
			MS(m/z):284(M <sup>+</sup> )	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -33.0° (c=0.1,DMSO)	
·	<u> </u>		無色結晶	
	·		NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:2.22(6H,s),2.63(2	
	ļ:		H.t.J=6Hz),2.80(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.8	
•			6(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.19(2H,br-s),3.8	
		Me-N O-	2(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),4.02(1H,t,J=8.5H	
	256		z),4.10(2H,t,J=6Hz),4.55-4.61(1H,m),7	
N. 14		F	.14-7.21(2H,m),7.52(1H,dd,J=15.5,2.5	
•			Hz)	
			IR v (KBr) cm <sup>-1</sup> :1730,3328	
			MS(m/z):297(M*)	
	<u> </u>		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -40.0° (c=0.1,DMSO)	•
			淡黄色プリズム状晶  [iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> O]	
	1		mp.61~63°C	
	257	Me <sub>2</sub> N 0-{}	mp, 01~63 C   元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>	
	237	<b>)</b>	理論值 C,57.86;H,7.12;N,13.50	
			実験値 C,57.61;H,6.78;N,13.19	
			失款值 0.37.01,71,0.76,14,13.19 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> –33.1° (c=0.1,DMSO)	
•	L	J	MACAGE [430 -33.1 (G-0.1,DMSU)	

[0137]

【表62】

*			A-N NH <sub>2</sub>	
	参考例	A	物性[再結晶溶媒]	
			無色無晶形固体	
	1 .		NMR(DMSO-de) & ppm:1.53(2H,quin,J=7	
			Hz),1.55(2H,br-s),1.72(2H,quin,J=7Hz)	
			,2.12(6H,s),2.24(2H,t,J=7Hz),2.79(1H,d	
•		1	d,J=13.5,5Hz),2.85(1H,dd,J=13.5,5Hz),	
•	050	Me <sub>2</sub> N	3.82(1H,dd,J=9,6Hz),4.02(1H,t,J=9Hz),	· · · · ·
	258		4.03(2H,t,J=7Hz),4.54-4.61(1H,m),7.16	
			(1H,t,J=9Hz),7.19(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.	
		•	54(1H,dd,J=14,2.5Hz)	
			IR_v (KBr) cm <sup>-1</sup> :1728,3336,3420	
		75/23/2010	MS(m/z):325(M <sup>+</sup> )	
,,			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -24.1°(c=0.1,DMSO)	
			淡褐色液体	
- <del></del>		A. T. A. S. A. A. S. A. A. A. A. A. A. A. A. A. A. A. A. A.	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:1.44(2H,br-s),2.26(6	
•			H,s),2.48(2H,t,J=7.5Hz),2.84(3H,s),2.9	
			7(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.10(1H,dd,J=13.	,
	-	Me <sub>2</sub> N	5.5Hz),3.22(2H,t,J=7.5Hz),3.81(1H,dd,	
	259	Ma )/	J=8.5,6.5Hz),4.00(1H,t,J=8.5Hz),4.60-	
		F	4.70(1H,m),6.91(1H,t,J=9Hz),7.05-7.15	
			(1H,m),7.38(1H,dd,J=14.5,2.5Hz)	
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1750,3384	
	·	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	MS(m/z):310(M <sup>+</sup> )	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -34.8° (c=0.1,DMSO)	•
			黄色液体	
		2 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	NMR(CDCl <sub>3</sub> ) & ppm:1.25(2H,br-s),2.25(6	:
	·		H.s),2.51(2H,t,J=7.5Hz),2.96(2H,t,J=7.	<u> </u>
		<u> </u>	5Hz),2.95-3.00(1H,m),3.13(1H,dd,J=13	
•	0.60	Mo <sub>2</sub> N S	.5,4.5Hz),3.86(1H,dd,J=8.5,6.5Hz),4.02	
· · ·)	260	<u>}</u> —	(1H,t,J=8.5Hz),4.65-4.70(1H,m),7.21(1	
			H.dd,J=8.5,2.5Hz),7.41(1H,t,J=8.5Hz), 7.47(1H,dd,J=11.5,2.5Hz)	
		anju i unalezan	7.47(In.αα,3–11.5,2.5Hz) IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1754,3384	
	. [		MS(m/z):313(M*)	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -42.8° (c=0.1,DMSO)	
	L	<u> </u>	1 10 MC 76 MC 1 MC 10 - 12.0 (C-0.1,DMSU)	

[0138]

【表63】

			A-N NH,	
	参考例	A	物性[再結晶溶媒]	
. '			淡褐色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	
	1		mp,91.5~92℃	
	004		元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>17</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	l
	261	Me <sub>2</sub> N	理論值 C,61.26;H,7.28;N,17.86	1
			実験値 C,60.90;H,7.16;N,17.60	
		i ya yana en win Jinga ani a san	比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -32.9° (c=0.1,DMSO)	
			赤褐色結晶	ļ
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:1.88(2H,br-s),2.7	
-			4(6H,s),2.79(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.85(1	l
		and the second second	H,dd,J=13.5,5Hz),3.80(1H,dd,J=9,6Hz).	
	262	Me <sub>2</sub> N—	4.00(1H,t,J=9Hz),4.50-4.65(1H,m),6.97	
	202		(1H,t,J=8.5Hz),7.16(1H,dd,J=8.5,2.5Hz	
			),7.44(1H,dd,J=15.5,2.5Hz)	
			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1732,3336,3372	Ė
		The second secon	MS(m/z):253(M*)	
		a company de la company de la company de la company de la company de la company de la company de la company de	比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -45.0° (c=0.1,DMSO)	
			無色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	_
		No.	mp,51∼52℃	
	263		元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	
	† · · · · ·	E /	— 理論值 C,58.41;H,6.79;N,15.72	H
		*	実験値 C,58.42;H,6.78;N,15.52	
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -45.8° (c=0.1,DMSO)—	
			褐色液体	
			-NMR(DMSO-d <sub>6</sub> )δ-ppm:0:99(6H,t,d=7 <del>.5</del> H	Ė
	1.54 1		z),1.55(2H,br-s),2.80(1H,dd,J=14,5Hz)	-
	***********		.2.85(1H,dd,J=14,5Hz).3.11(4H,q,J=7,5	27
	004	Et_N-	Hz),3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),4.02(1H,t,J	
	264		=9Hz),4.55-4.65(1H,m),7.02(1H,t,J=9.5	1,
			Hz),7.17(1H,dd,J=9.5,2.5Hz),7.43(1H,d	ĺ
		*	d,J=15.5,2.5Hz)	ŀ
	7		IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1750,3392	
		Reduced to the first transfer	MS(m/z):281(M <sup>+</sup> )	-
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -33.3° (c=0.1,DMSO)	
			無色プリズム状晶[iso-PrOH-n-Hexane] mp,81~82.5℃	, 
			The state of the s	
	265		元素分析值 C <sub>14</sub> H, <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub>	
			理論值 C.68.27;H,7.37;N,11.37	1
			実験値 C,68.03;H,7.53;N,11.31	
	L	·	比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -36.0° (c=0.1,DMSO)	

[0139]

<u></u>			A=N
	·		NH <sub>2</sub>
	参考例	A	物性[再結晶溶媒]
		· •	淡褐色結晶
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.21(3H,t,J=7.5H
•			z).2.15(2H,br-s),2.68(4H,t,J=4.5Hz),2,
		***	80(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.85(1H,dd,J=13
			.5,5Hz),2.99(4H,t,J=4.5Hz),3.26(2H,s),
		Eto,c N N-	3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),4.02(1H,t,J=9H
	266		z).4.11(2H,q,J=7.5Hz),4.55-4.65(1H,m)
			.7.05(1H,t,J=9Hz),7.18(1H,dd,J=9,2.5H
•			z),7.47(1H,dd,J=14.5,2.5Hz)
		1.34.	IR v (KBr) cm <sup>-1</sup> :1740,3388
			MS(m/z):380(M <sup>+</sup> )
•	, ,		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -34.0° (c=0.1,DMSO)
			無色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> 0]
			mp,88~88.5℃
		_N N—	元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>
	267	BO <sub>2</sub> C - S	理論値 C,57.85;H,6.90;N,14.20
			実験値 C.57.57;H.7.15;N.14.06
•			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -30.0° (c=0.1,DMSO)
			淡褐色結晶
			NMR(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ ppm:1.19(3H,t,J=7.5H
	:		z),1.71(2H,quin,J=7.5Hz),1.71(2H,br-s
		*** - Tallahara Walland	),2.31(2H,t,J=7.5Hz),2.34(2H,t,J=7.5H
			z),2.50(4H,t,J=5Hz),2.80(1H,dd,J=13.5
	·	EtO <sub>2</sub> C N N-	.5Hz),2.85(1H,dd,J=13.5,5Hz),2.97(4H,
	268	حر ب	t,J=5Hz),3.81(1H,dd,J=9,6.5Hz),4.01(1
		·	H,t,J=9Hz),4.06(2H,q,J=7.5Hz)4.55=4.
			65(1H,m), 7.03(1H,t,J=9Hz),7.18(1H,d
	\$		d,J=9,2.5Hz),7.47(1H,dd,J=15.5,2.5Hz)
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1732,3348
			MS(m/z):408(M <sup>+</sup> )
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> 20-26.9° (c=0.1,DMSO)
	ĺ		無色プリズム状晶[iso-PrOH]
			mp.109~111℃
	269	MeO <sub>2</sub> C-N N-	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>21</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>
	205		理論值 C,54.54;H,6.01;N,15.90
			実験値 C,54.31;H,6.00;N,15.83
	L	<u> </u>	比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-29.7° (c=0.07,DMSO)

[0140]

【表65】

			A-N NH-	
	参考例	AAAA	物性[再結晶溶媒]	1
			淡黄色結晶[iso-PrOH]	$\top$
			mp,134~135°C	
٠		<b>№</b> N-(=>-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	
	270		理論值 C,56.83;H,6.62;N,14.73	İ
		MeO F	実験值 C,56.86;H,6.74;N,14.66	
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO)	١.
			淡黄色結晶	_
			NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) $\delta$ ppm:1.89(2H,br-s),2.2	1
			2(3H,s),2,46(4H,t,J=5Hz),2.79(1H,dd,J	
			=14,5Hz),2.84(1H,dd,J=14,5Hz),2.98(4	١.
	). ·		H,t,J=5Hz),3.81(1H,dd,J=9,6Hz),4.01(1	
. *	271	MoN_N-	H.t.J=9Hz),4.54-4.61(1H,m),7.03(1H,t,	-
		<b>F</b>	J=8.5Hz),7.18(1H,dd,J=8.5,2Hz),7.46(1	
			H,dd,J=15.5,2Hz)	1
			-IR-v (KBr) cm <sup>-1</sup> :1734,3328,3372	
		A State of the second	MS(m/z):308(M+)	
	-		比旋光度 [α] <sub>p</sub> 20-34.0° (c=0.1,DMSO)	.··.
	- 31	1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	無色針状晶[AcOEt-iso-Pr,O]	1
			mp.104~105.5℃	
	272	EUN N	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	
	2/2	کر ک	理論值 C,59.61;H,7.19;N,17.38	
		CONTRACTOR OF THE CONTRACTOR O	実験値 C,59.46;H,7.17;N,17.37	
		A second of the	比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -37.0° (c=0.1,DMSO)	
		The second secon	淡褐色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]	
	1. 1.		mp,93~95℃	
	273	n-PrN N-	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	
	2,0		理論值 C,60.70;H,7.49;N,16.65	
	1 200		実験値 C,60.47;H,7.38;N,16.55	
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-37.9° (c=0.1,DMSO)	
			淡黄色結晶[iso-PrOH-iso-Pr <sub>2</sub> 0]	
			mp,98~100℃	
7	274	n-BuN N	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> -2/5H <sub>2</sub> O	
			理論值 C,60.45;H,7.83;N,15.67	ľ
	1	1	I PREAM A AA AA AA AA AA AA	

[0141]

【表66】

実験値 C,60,62;H,7.81;N,15.46 比旋光度 [α]<sub>D</sub><sup>20</sup>-34.1° (c=0.1,DMSO) Ö

· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		:	Ä.	
<u> </u>			A-N	
			NH <sub>2</sub>	
	参考例_	A	物性[再結晶溶媒]	L
, *			淡黄褐色液体	ĺ
. •			NMR(DMSO-d <sub>a</sub> ) δ ppm:1.54-1.62(2H,m),	ĺ
			1.82(2H,br-s),1.85-1.92(2H,m),2.81(1	ŀ
		• • • •	H,dd,J=14,5Hz),2.86(1H,dd,J=14,5Hz),	
•			3.22-3.29(2H,m),3.60(3H,s),3.64-3.70(	l
		MoO.C-N	2H,m),3.82(1H,dd,J=9,6Hz),4.03(1H,t,J	l
***************************************	275		=9Hz),4.45-4.52(1H,m),4.57-4.63(1H,	_
		F .	m),7.22(1H,dd,J=9,2.5Hz),7.25(1H,t,J=	
		<u>-</u>	9Hz),7.54(1H,dd,J=13.5,2.5Hz)	ĺ
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1688,1748,3368	ĺ
			MS(m/z):367(M*)	
	· · ·		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -26.0° (c=0.1,DMSO)	H
1 .			無色プリズム状晶[AcOEt]	
			mp,119.5~122°C	
		MeO.C-N	元素分析值 C15H14FN3O5・1/6H2O	
•	276		理論值 C,52.63;H,5.40;N,12.28	
		F	実験値 C,52.49;H,5.29;N,12.27	
	,		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -30.9° (c=0.1,DMSO)	
	<del></del>	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	淡黄色液体	
			NMR(DMSO=d <sub>6</sub> ) δ-ppm:1-50=1-70(2H <sub>2</sub> m),	_
	]		1.80-2.00(2H,m),1.91(2H,br-s),2.57(2	
			H,t,J=6.5Hz),2.81(1H,dd,J=13.5,5Hz),2	
	ļ		.86(1H,dd,J=13.5,5Hz),3.20-3.40(2H,m	ŀ
1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	<u> </u>		),3-23(3H,s),3-56(2H,t,J=6-5Hz),3-82(1	ļ
•	277		H,dd,J=9,6Hz),4.03(1H,t,J=9Hz),4.45-	l
		MeO F	4.55(1H,m),4.55-4.65(1H,m),7.22(1H,d	L
			d,J=9,2.5Hz),7.25(1H,t,J=9Hz),7.54(1H	ĺ
• • •			,dd,J=13.5,2.5Hz)	ĺ
			IR ν (liq.) cm <sup>-1</sup> :1634,1750,3464	
)	ľ		MS(m/z):395(M <sup>+</sup> )	
**			比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-34.7°(c=0.1.DMSO)	
	7.		淡褐色結晶[DMF]	
•	·		mp,186~188°C	
	070		元素分析值 C₁aH₁aFN₃O₂	
	278		理論值 C,66.04;H,5.54;N,12.84	ı
	i	F	TTEA # 0 00 00 11 5 50 11 40 75	ı

## 【0142】実施例1

(S) -N-[2-オキソ-3-[4-(チオモルホリ ン-4-イル) フェニル] オキサゾリジン-5-イル] メチルジチオカルバミド酸メチル

(S) -5-アミノメチル-2-オキソ-3-[4-(チオモルホリン-4-イル) フェニル] オキサゾリジ ン1.00gとトリエチルアミン0.48mlのジクロロ メタン10㎡溶液に氷冷攪拌下、二硫化炭素0.40㎡ を加えた後、同温で4時間攪拌した。この混合液にヨウ 【0143】実施例1と同様にして実施例2~56の化 化メチル0.22回を加え、氷冷下で30分間撹拌し た。反応液に水を加えジクロロメタンで抽出した。抽出

液を飽和食塩水で洗浄し、芒硝乾燥後、溶媒を減圧留去 し、淡褐色結晶を得た。酢酸エチルから再結晶し、融点 157.5~158.5℃の淡褐色結晶0.80gを得 た。

元素分析值 C<sub>16</sub>H<sub>21</sub>N<sub>3</sub>O<sub>2</sub>S<sub>3</sub>

実験値 C,66.02;H,5.50;N,12.75 比旋光度 [α]<sub>p</sub><sup>20</sup>-35.1° (c=0.1,DMSO)

理論値 C,50.10; H,5.52; N,10.96

実験値 C,50.16; H,5.55; N,10.77

比旋光度  $[\alpha]_{D}^{20}-27.8^{\circ}$  (c=0.1, DMSO)

合物を得た。

[0144]

	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		S S
	実施例	Α	物性[再結晶溶媒]
		# t	無色結晶[MeOH]
			mp,106~108℃
	2	\$\\\\_\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\	元素分析值 C <sub>1e</sub> H <sub>2o</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>3</sub>
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·			—理論值 C,47.86;H,5.02;N,10.46
			実験值 C,48.00;H,4.92;N,10.25
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)
			無色結晶[MeOH]
			mp,149.5≈151°C
	3		元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	. 3	F	理論值_C,52.01;H,5.46;N,11.37
		(A)	実験值 C,52.03;H,5.41;N,11.32
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> –23.0° (c=0.1.DMSO)
			無色針状晶[MeOH]
·			mp,149~152℃
171	4	~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	-	F	理論值 C,53.24;H,5.78;N,10.96
			突験值 C,53.22;H,5.71;N,10.86
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -27.0° (c=0.1.DMSO)
·	ž		無色結晶[AcOEt−iso-Pr₂O]
	A		mp,128~129℃
	5	MeO—\N-\	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
		F	理論值 C,52.28;H,5.85;N,10.16
•			実験値 C,52.20;H,5.84;N,10.09
		***	比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -26.1° (c=0.1,DMSO)
•			無色結晶[MeOH]
			mp,151.5∼153.5°C
	6	EtO————————————————————————————————————	元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>
		<b>F</b>	理論值 C,53.37;H,6.13;N,9.83
			実験值 C,53.36;H,6.04;N,9.85
[0145]			比族光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.1° (c=0.1,DMSO)

[0145]

【表68】

• •	実施例	Α	物性[再結晶溶媒]
			無色針状晶[AcOEt]
•			mp,150~151°C
٠	,	Mo-(N-(-)-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	7		理論值 C.54.38;H.6.09;N.10.57
			実験值 C,54.23;H,6.02;N,10.50
		, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -28.9° (c=0.1,DMSO)
			無色針状品[MeOH]
			mp.148~149℃
) ·		Et-\	元素分析值 C,,,H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	8		理論值 C.55.45;H,6.37;N,10.21
- man 1		يه موطهندين پد وهافيدي	実験値 C,55.39;H,6.48;N,10.09
			-比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)
			無色結晶[iso-PrOH]
•			mp,149.5∼151.5℃
	9	Bri————————————————————————————————————	元素分析值 C <sub>24</sub> H <sub>28</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	9		理論值 C,60.86;H,5.96;N,8.87
	1.		実験值 C,60.83;H,6.02;N,8.81
		To the second of	-比旋光度-[α]。 <sup>20</sup> -12.0° (c=0.1.DMSO)
			無色針状晶[AcOEt]
The state of the s	1	The second secon	mp,139.5~141℃
	10	MeO N-	元素分析值 C₂₀H₂₄FN₃O₄S₂
	10		理論值 C,52.50;H,6.17;N,9.18
~ )			実験值 C,52.25;H,6.42;N,9.22
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-25.1° (c=0.1,DMSO)
			淡褐色結晶[EtOH]
-			mp,122.5∼124.5℃
	11	MeO-\N-\(\bigcap\)	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>
	''	F	理論值 C.49.85;H.5.23;N.10.90
			実験值 C,49.71;H,5.15;N,10.80
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> 20-29.9° (c=0.1,DMSO)

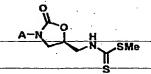
[0146]

【表69】

実施例   A   物性[再結品溶媒]   無色針状品[iso-PrOH]   mp,112~113.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C <sub>5</sub> 0.33;H <sub>5</sub> .63;N <sub>3</sub> .9.78   実験値 C <sub>5</sub> 0.20;H <sub>5</sub> .58;N <sub>3</sub> .9.72   比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -24.0° (c=0.1,DMSO)   mp,132.5~138.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C <sub>5</sub> 4.38;H <sub>6</sub> .09;N <sub>4</sub> 10.46   比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)   液母色針状品[iso-PrOH]   mp,132.5~138.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C <sub>5</sub> 3.62;H <sub>6</sub> 33;N <sub>1</sub> 10.46   比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)   液母色針状品[coEt]   mp,164~165.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C <sub>5</sub> 3.62;H <sub>6</sub> 33;N <sub>3</sub> 9.74   比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)   無色針状品[EtOH]   mp,148.5~149.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>6</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C <sub>5</sub> 1.68;H <sub>6</sub> .16;N <sub>3</sub> 9.52   実験値 C <sub>5</sub> 1.55;H <sub>6</sub> .34;N <sub>3</sub> 9.46   比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状品[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,143.5~145℃   元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C <sub>5</sub> 1.04;H <sub>5</sub> 50;N <sub>3</sub> 9.92   実験値 C <sub>5</sub> 0.95;H <sub>4</sub> .86;N <sub>3</sub> 9.78   比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -37.9° (c=0.1,DMSO)					_
mp,112~113.5℃   元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論值 C,50.33;H,5.63;N,9.78   実験值 C,50.20;H,5.85;N,9.72   比能光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.0° (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状晶[iso-PrOH]   mp,137.5~138.5℃   元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論值 C,54.25;H,6.34;N,10.46   比能光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)   浓分析值 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論值 C,53.62;H,6.39;N,9.87   実験值 C,53.62;H,6.39;N,9.87   実験值 C,53.62;H,6.39;N,9.74   比能光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[EtOH]   mp;148~149.5℃   元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>6</sub> S <sub>2</sub>   理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52   実験值 C,51.55;H,6.34;N,9.46   比能光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,143.5~145℃   元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92   実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78	*	実施例	<b>A</b>	物性[再結晶溶媒]	
元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,50.33;H,5.63;N,9.78 実験値 C,50.20;H,5.85;N,9.72 比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -24.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[iso-PrOH] mp,137.5~138.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,54.25;H,6.34;N,10.46 比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO) 淡褐色針状晶[AcOEt] mp,164~165.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87 実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[EtOH] mp;148~149.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>6</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比能光度 [α] <sub>5</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78	•			無色針状晶[iso-PrOH]	1
元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,50.33;H,5.63;N,9.78 実験値 C,50.20;H,5.85;N,9.72 比接光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶 [iso-PrOH] mp.13Z.5~138.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,54.25;H,6.34;N,10.46 比嵌光度 [α] <sub>0</sub> <sup>30</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO) 淡褐色針状晶 [AcOEt] mp.164~165.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87 実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比接光度 [α] <sub>0</sub> <sup>30</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶 [EtOH] mp.148~149.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比埃光度 [α] <sub>0</sub> <sup>30</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶 [THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.143.5~145℃ 元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78		·		mp,112~113.5℃	İ
理論値 C,50.33;H,5.63;N,9.78   実験値 C,50.20;H,5.85;N,9.72   比較光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.0° (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状晶[iso-PrOH]   mp.137.5~138.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,54.38;H,6.09;N,10.57   実験値 C,54.25;H,6.34;N,10.46   比較光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)   淡褐色針状晶[AcOEt]   mp.164~165.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87   実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74   比較光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[EtOH]   mp.148~149.5℃   元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,51.63;H,6.16;N,9.52   実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46   比較光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp.143.5~145℃   元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92   実験値 C,51.04;H,5.00;N,9.92   実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78			Meo_o_N_	元素分析值 C₁₅H₂₄FN₃O₄S。	
実験値 C,50.20;H,5.85;N,9.72 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.0° (c=0.1,DMSO) 無色プリズム状晶[iso-PrOH] mp.137.5~138.5℃ 元素分析値 C <sub>16</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,54.38;H,6.09;N,10.57 実験値 C,54.25;H,6.34;N,10.46 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO) 淡褐色針状晶[AcOEt] mp.164~165.5℃ 元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87 実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[EtOH] mp.148~149.5℃ 元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 実験値 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.143.5~145℃ 元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78		12	F		
上旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.0° (c=0.1,DMSO)   無色プリズム状晶[iso-PrOH]   mp.137.5~138.5°C   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,54.38;H,6.09;N,10.57   実験値 C,54.25;H,6.34;N,10.46   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)   淡褐色針状晶[AcOEt]   mp.164~165.5°C   元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>2</sub> ,N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87   実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[EtOH]   mp.149.5°C   元素分析値 C <sub>10</sub> H <sub>2</sub> ,N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,51.68;H,6.16;N,9.52   実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp.143.5~145°C   元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92   実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78	•	•			Γ
無色プリズム状晶[iso-PrOH] mp.137.5~138.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,54.38;H,6.09;N,10.57 実験値 C,54.25;H,6.34;N,10.46 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO) 淡褐色針状晶[AcOEt] mp.164~165.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87 実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[EtOH] mp.148~149.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>6</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp.143.5~145℃ 元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78					ļ
mp,137.5~138.5°C   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C.54.38;H,6.09;N,10.57   実験値 C.54.25;H,6.34;N,10.46   比旋光度 [α] <sub>3</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)   淡褐色針状晶[AcOEt]   mp,164~165.5°C   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C.53.62;H,6.39;N,9.87   実験値 C.53.40;H,6.30;N,9.74   比旋光度 [α] <sub>3</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[EtOH]   mp,148~149.5°C   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C.51.68;H,6.16;N,9.52   実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46   比旋光度 [α] <sub>3</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,143.5~145°C   元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92   実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78					ľ
元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,54.38;H,6.09;N,10.57 実験値 C,54.25;H,6.34;N,10.46 比旋光度 [α] <sub>2</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)					
理論值 C,54.38;H,6.09;N,10.57    実験値 C,54.25;H,6.34;N,10.46     比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)     淡褐色針状晶[AcOEt]     mp,164~165.5℃     元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>2</sub> ,N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>     理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87     実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74     比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)     無色針状晶[EtOH]     mp;148~149.5℃     元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>2</sub> ,N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub>     理論値 C,51.68;H,6.16;N,9.52     実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46     比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)     無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]     mp,143.5~145℃     元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>     理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92     実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78	- •			The state of the s	Γ
実験値 C,54.25;H,6.34;N,10.46 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO) 淡褐色針状晶[AcOEt] mp,164~165.5°C 元素分析值-C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,53.62;H,6.39;N,9.87 实験值 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[EtOH] mp,148~149.5°C 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>6</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52 实験值 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145°C 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論位 C,51.04;H,5.00;N,9.92 实験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78		13			İ
上旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -24.1° (c=0.1,DMSO)   淡褐色針状晶[AcOEt]   mp.164~165.5℃   元素分析値 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C.53.62;H,6.39;N,9.87   実験値 C.53.40;H,6.30;N,9.74   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[EtOH]   mp.148~149.5℃   元素分析値 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C.51.68;H,6.16;N,9.52   実験値 C.51.55;H,6.34;N,9.46   比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp.143.5~145℃   元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C.51.04;H,5.00;N,9.92   実験値 C.50.95;H,4.86;N,9.78			F and a second contraction of the second con		
淡褐色針状晶[AcOEt]   mp,164~165.5℃   元素分析値-C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87   実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74   比旋光度 [α] <sub>n</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[EtOH]   mp;148~149.5℃   元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,51.68;H,6.16;N,9.52   実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46   比旋光度 [α] <sub>n</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)   無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]   mp,143.5~145℃   元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>   理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92   実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78		.,,			
mp,164~165.5℃ 元素分析值-C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,53.62;H,6.39;N,9.87 実験值 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比族光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[EtOH] mp;148~149.5℃ 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78			The second secon		ľ
元素分析値-C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,53.62;H,6.39;N,9.87 実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[EtOH] mp;148~149.5℃ 元素分析値 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78	•			1	ŀ
理論值 C,53.62;H,6.39;N,9.87 実験值 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比族光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[EtOH] mp,148~149.5℃ 元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78					İ
実験値 C,53.40;H,6.30;N,9.74 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[EtOH] mp;148~149.5°C 元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145°C 元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78		14			-
比旋光度 [α] <sub>n</sub> <sup>20</sup> -21.0° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[EtOH]  mp,148~149.5°C  元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>2</sub> ,N <sub>3</sub> O <sub>8</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52  実験值 C,51.55;H,6.34;N,9.46  比旋光度 [α] <sub>n</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O]  mp,143.5~145°C  元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92  实験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78		1	n-PrO	100	
無色針状晶[EtOH] mp;148~149.5℃ 元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> ~22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78	Tito.				
mp,148~149.5℃ 元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験值 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> −22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF−iso−Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78	<u> </u>				==
元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験值 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> ~22.1° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[THF~iso~Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78			e estan frage	-	
理論值 C,51.68;H,6.16;N,9.52 実験值 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)  無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78	-				
実験値 C,51.55;H,6.34;N,9.46 比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> ~22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF~iso~Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析値 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論値 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78		15			
比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO) 無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78			MeO-		
無色針状晶[THF-iso-Pr <sub>2</sub> O] mp,143.5~145℃ 元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78			**	, , , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	١.
mp,143.5~145℃ 元素分析值 C,₂H,₄N₂O₂S₂ 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78			- man of the second sec	a select the selection of the selection	
元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>14</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> 理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78			1 6 km s		1.
理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78					
理論值 C,51.04;H,5.00;N,9.92 実験值 C,50.95;H,4.86;N,9.78	•	16			
比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> –37.9° (c=0.1,DMSO)				実験値 C,50.95;H,4.86;N,9.78	
			<u> </u>	比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -37.9° (c=0.1,DMSO)	

[0147]

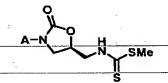
【表70】



,	実施例	Α	物性[再結晶溶媒]
			微黄色針状晶[EtOH]
			mp.147~149°C
=		/=\	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	17	Me	理論值 C.52.68;H,5.44;N,9.45
٠		,	実験値 C,52.70;H,5.32;N,9.48
	·		比旋光度 [α] <sub>p</sub> ²º-35.1° (c=0.1,DMSO)
			無色結晶[EtOH]
			mp,112.5∼113.5°C
)			元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>16</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	18		理論值_C,52.68;H,5.44;N,9.45
a de la companya de la companya de la companya de la companya de la companya de la companya de la companya de La companya de la companya de la companya de la companya de la companya de la companya de la companya de la co		r <del>ac</del>	実験値 C,52.65;H,5.37;N,9.46
د د میسود		i e erein y i	比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-36.1° (c=0.1,DMSO)
			無色羽毛状晶[MeOH]
-			mp,120~121°C
•		Me—	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	19	Me.	理論值 C.54.17;H,5.84;N,9.02
•			実験値 C,54.03;H,5.72;N,8.94
			比淀光度-[α] <sub>0</sub> 20-35.0° (c=0.1,DMSO)
			無色針状晶[EtOH]
			mp,128~129°C
		F1	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	20		理論值 C,54.17;H,5.84;N,9.02
	· -		実験値 C,53.94;H,5.87;N,8.90
· ·			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> –37.9° (c=0.1,DMSO)
			無色針状晶[AcOEt-n-Hexane]
		,	mp,112∼113℃
		Mag	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>
	21		理論值 C.49.98;H,5.16;N,8.97
•		i	実験値 C,49.83;H,5.00;N,8.85
		· : .	比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> –11.0° (c=0.1,MeOH)

[0148]

【表71】



`		
実施例	1 A	物性[再結晶溶媒]
Y.		無色羽毛状晶[iso-PrOH]
		mp,117~119℃
	n-Pro-	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>20</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>
22	n-P10-	理論值 C,52.92;H,5.92;N,8.23
		実験值 C,52.92;H,6.09;N,8.20
		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -31.0° (c=0.1,DMSO)
1. "		無色針状晶[AcOEt]
		mp,144.5~146°C
	MeO-	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>
23	MeO	理論值 C,49.10;H,5.30;N,8:18
		実験值 C,49.01;H,5.25;N,7.99
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -30.0° (c=0.1,DMSO)
		無色結晶[EtOH]
		mp,111.5~113.5°C
		元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>22</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
24	11-00	理論值 C,56.77;H,6.55;N,8.28
		実験値 C,56.77;H,6.46;N,8:25
		比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -31.0° (c=0.1,DMSO)
		無色結晶[MeOH]
		mp.137.5∼138.5℃
		元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>13</sub> FN <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
25		理論值 C,47.98;H,4.36;N,9.33
Oleman .		実験值 C,47.90;H,4.28;N,9.31
		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -32.9° (c=0.1,DMSO)
		無色針状晶[MeOH]
	350	mp.149.5∼151.5°C
	F—	元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>12</sub> F <sub>2</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
26	F	理論值 C,45.27;H,3.80;N,8.80
e .		実験値 C,45.27;H,3.68;N,8.85
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -37.1°(c=0.1,DMSO)

[0149]

【表72】

		S
実施例	Α	物性[再結晶溶媒]
		淡褐色針状晶[EtOH]
1		mp,147∼149℃
		元素分析值 C <sub>12</sub> H <sub>13</sub> ClN <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
27	CI-V	理論值 C.45.49;H,4.14;N,8.84
		実験値 C,45.57;H,4.02;N,8.93
	<u> </u>	比旋光度 [α] <sub>p</sub> ²º-42.2° (c=0.1,DMSO)
·		無色針状晶[EtOH]
		mp,159.5∼161.5°C
	E C	元素分析值 C <sub>13</sub> H <sub>13</sub> F <sub>3</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
28	Lac	理論值 C,44.56;H,3.74;N,8.00
		実験值 C,44.54;H,3.66;N,8.05
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> –28.9° (c=0.1,DMSO)
		淡黄色プリズム状晶[CH₃CN]
	, , , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	mp,164.5∼165.5°C
29		元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>
29	Mo L	理論值 C,51.83;H,4.97;N,8.63
	Account to the second s	実験値 C,51.69;H,4.88;N,8.87
		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO)
		無色無晶形固体
		NMR スペクトル(DMSO-d <sub>6</sub> ) & ppm:2.55(3H,
		),3.85(1H,dd,J=9,6Hz),3.98-4.00(2H,m),4.
		6(1H,t,J=9Hz),4.90-5.00(1H,m),6.99(2H,de
30		,J=8.5,1Hz),7.06(2H,d,J=9Hz),7.11(1H,t,J=
		7.5Hz),7.37(2H,dd,J=8.5,7.5Hz),7.55(2H,d
	•	J=9Hz),10.17(1H,br-в)
. 1		IR ν (KBr)cm <sup>-1</sup> :1738,3224
-		比旋光度 [α] <sub>p</sub> ²⁵-15.0° (c=0.1,MeOH)

[0150]

【表73】

	実施例	Α	物性[再結晶溶媒]
			無色結晶[AcOEt]
-			mp,123~125℃
	31	<b>\_</b> -o- <b>\_</b> }_	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>
	31	F	理論值 C,51.89;H,4.10;N,10.68
			実験值 C,52.04;H,4.22;N,10.68
		4	比旋光度 [α] <sub>0</sub> ²º-30.1° (c=0.1,DMSO)
		)	無色結晶[AcOEt]
			mp,128~129℃
		MeQ p-{	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>19</sub> EN <sub>2</sub> O <sub>4</sub> S,
	32		理論值 C,48.11;H,5.11;N,7,48
	7	A Commence of the	· 実験值 C,47.90;H,4.95;N,7.47
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> 20-26.0° (c=0.1,DMSO)
-			淡黄色プリズム状晶[EtOH]
			mp,120~121°C
		Me <sub>2</sub> N p-	-元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S,
	33		理論值 C,49.59;H,5.72;N,10.84
			実験値 C,49.47;H,5.46;N,10.62
المراجعة والمستعدد والمستعدد	8:		比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> –25.1° (c=0.1,DMSO)
			無色結晶[AcOEt]
•			mp,128~130℃
		Mo-N O	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>24</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>
	34	\	理論值 C,50.85;H,6.02;N,10.47
	; .· .	والمنطوعية المناف الأسادة الأسادة الأسادة الأسادة الأسادة المسادة الأس	実験値 C,50.73;H,5.87;N,10.36
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> 20-29.0° (c=0.1,DMSO)
			無色針状晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> O]
			mp,96.5∼98.5℃
•		Me <sub>2</sub> N ~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>26</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S <sub>2</sub>
	35	) <u> </u>	理論值 C,52.03;H,6.31;N,10.11
			実験値 C,52.03;H,6.01;N,10.14
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> ²º-31.1° (c=0.1,DMSO)
•		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	1 100 (0 01101100)

[0151]

【表74】

	実施例	Α	物性[再結晶溶媒]
		·.	淡褐色プリズム状晶[EtOH]
		Me 🚍	mp,124~126℃
	26	Me-N N	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> ·2HCl·1/2H <sub>2</sub> O
	36	F	理論値 C,42.32;H,5.85;N,11.61
•	. "	• 2HCi	実験值 C.42.56;H,5.84;N,11.24
* * * * * * * * * * * * * * * * * * * *			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -18.2* (c=0.1,DMSO)
			淡黄色結晶[EtOH]
)		<i>;</i> ·	mp,129~131℃
	07	Me <sub>2</sub> N~S	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>3</sub> ·1/4H <sub>2</sub> O
The same is the	37	<b>-</b>	理論值 C.47.09;H,5.56;N,10.30
	ļ. 		実験値 C;47.21;H;5.44;N,10.37
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> ²º-30.9° (c=0.1,DMSO)
	. ,		無色針状晶[iso-PrOH]
			mp;145~146.5°C
	38	Ma.N	元素分析值_C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	36		理論值 C,51.67;H,5.88;N,12.91
		, , , , , , , , , , , , , , , , , , ,	実験値 C,51.58;H,5.74;N,12.89
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> ²º-23.9° (c=0.1,DMSO)
			淡黄色針状晶[iso-PrOH]
•	<u> </u>		mp,112.5~113°C
}	39	Me <sub>2</sub> N-	元素分析值 C <sub>14</sub> H <sub>18</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	33	F F	理論值 C,48.96;H,5.28;N,12.24
		The second secon	実験値 C,48.95;H,5.57;N,12.19
			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -30.0° (c=0.1,DMSO)
		·	無色針状晶[iso-PrOH]
	1		mp,112.5~113.5°C
	1 40	Me	元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
	40	Er )—	理論値 C,50.40;H,5.64;N,11.75
•••			実験値 C,50.35;H,5.93;N,11.69
•			比旋光度〔α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -33.9° (c=0.1,DMSO)

[0152]

【表75】

実施例	5 N. Z. A	物性[再結晶溶媒]
		淡黄色針状晶[iso-PrOH]
		mp,113.5~114.5°C
	Et <sub>2</sub> N-	元素分析值 C <sub>16</sub> H <sub>22</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
41	<u> </u>	理論值 C,51.73;H,5.97;N,11.31
		実験值 C,51.67;H,6.13;N,11.27
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -28.1° (c=0.1,DMSO)
		無色針状晶[AcOEt]
		mp,140~141°C
		元素分析值 C <sub>15</sub> H <sub>18</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
42		理論值 C,55.87;H,5.63;N.8.69
		実験値 C,55.81;H,5.61;N,8.68
) }		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -32.1° (c=0.1,DMSO)
i .		無色羽毛状晶[iso-PrOH]
		mp,128.5~130.5°C
•		元素分析值 C <sub>1e</sub> H <sub>2o</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>
43		理論值 C,57.11;H,5.99;N,8.33
	A STATE OF THE STA	実験值-C,57.12;H,6.05;N;8-17
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -32.1° (c=0.1,DMSO)
And No. of a community of		淡褐色プリズム状晶[iso-PrOH]
		mp,144.5~145.5℃
	EtO,C N N-	元素分析值 C₂₀H₂γFN₄O₄S₂
44		理論值 C.51.05;H.5.78;N,11.91
<u> </u>	area and a second and a second and a second and a second and a second and a second and a second and a second a	実験值 C,50.84;H,5.82;N,11.68
		比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -19.9° (c=0.1,DMSO)

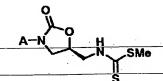
[0153]

【表76.

·	実施例	Α	物性[再結晶溶媒]
			淡黄色プリズム状晶[iso-PrOH]
	•		mp,149∼150°C
	45	EIO <sub>2</sub> C N	元素分析值 C₂₁H₂gFN₄O₄S₂
	45	F	理論值 C,52.05;H,6.03;N,11.56
			実験值 C,51.89;H,6.25;N,11.51
	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -22.1° (c=0.1,DMSO)
			淡褐色結晶[AcOEt-iso-Pr <sub>2</sub> 0]
. )	~		mp,108~109°C
	- 46	Eto*C N N-	元素分析值 C <sub>22</sub> H <sub>31</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub> ·1/5H <sub>2</sub> O
73 k	70	,	理論值 C,52.61;H,6.30;N,11.16
		1 - 1 - 1	実験値 C,52.47;H,6.27;N;11.07
•	·		比旋光度 [α] <sub>0</sub> ²0-13.0° (c=0.1,DMSO)
·			無色結晶[EtOH]
	<del></del>		mp,171~172:5℃
	47	MeO <sub>2</sub> C-N N-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>
	"	F F	理論值 C,48.85;H,5.24;N,12.66
			実験値-C,48:64;H,5:39;N,12:58
	<u> </u>		比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -27.9° (c=0.1,DMSO)
	' '	-%-	淡黄色針状晶[MeOH]
•	·		mp,168~170℃
)	48	Meo	元素分析值 C <sub>20</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>4</sub> S <sub>2</sub>
•		Fv	理論值 C,51.05;H,5.78;N,11.91
			実験値 C,50.88;H,5.67;N,11.87
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -24.9° (c=0.1,DMSO)

[0154]

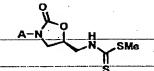
【表77】



	実施例	Α	物性[再結晶溶媒]	
	·	•	無色結晶[AcOEt−iso−Pr₂O]	
			mp,124.5~126°C	1
		Me-N N	元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>23</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>	1
· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	49		理論值 C,51.24;H,5.82;N,14.06	
		•	実験值 C,51.02;H,5.73;N,13.93	
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -35.0° (c=0.1,DMSO)	
			無色針状品[iso-PrOH]	
			mp;142~143.5°C	
•		Et-N N-	元素分析值 C <sub>18</sub> H <sub>25</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>	
	50	سر ب	理論值 C,52,40;H,6.11;N,13.58	
			実験值 C,52.21;H,6.24;N,13.45	
			比旋光度 [α] <sub>0</sub> <sup>20</sup> -32.0° (c=0.1,DMSO)	
•			無色針状晶[iso-PrOH]	
	1		mp,132~134°C	-
	ľ	n-Pr-N N	元素分析值 C <sub>19</sub> H <sub>27</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub> • 1/4H <sub>2</sub> O	
	51		理論值 C,52.94;H,6.43;N,13.00	
			実験値-C;53.12;H,6.51;N,13.14	+
		No.	比旋光度 [α] <sub>p</sub> ²º-29.0° (c=0.1.DMSO)	],
			無色結晶[iso-PrOH]	
			mp,136~138℃	
		n-Bu-N N-	元素分析值 C <sub>20</sub> H <sub>29</sub> FN <sub>4</sub> O <sub>2</sub> S <sub>2</sub>	
•	52		理論值 C,54.52;H,6.63;N,12.72	.
			実験值 C,54.57;H,6.60;N,12.67	1 1
			N =	
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> –24.9° (c=0.1,DMSO)	

[0155]

【表78】



[	実施例	A	物性[再結晶溶媒]
			<b>無色無晶形固体</b>
		•	NMR(DMSO-d <sub>s</sub> ) & ppm:1.54-1.62(2H,m),1.85
·			-1.95(2H,m),2.54(3H,s),3.20-3.30(2H,m),3.
`			60(3H,s),3.60-3.70(2H,m),3.81(1H,dd,J=9,
	53	MeO <sub>2</sub> C-N )-0-(_)	6HZ),3.98(2H,t,J=6Hz),4.13(1H,t,J=9Hz),4.
	J3	F F	45-4.55(1H,m),4.90-5.00(1H,m),7.20(1H,d
		·	d,J=9,2Hz),7.26(1H,t,J=9Hz),7.52(1H,dd,J
1		·	=13.5,2Hz),10.16(1H,br-s)
			IR ν (KBr) cm <sup>-1</sup> :1714,3244
- ·· ··		in a in	比旋光度 [α] <sub>n</sub> <sup>20</sup> -24:1° (c=0:1,DMSO)
· 			無色プリズム状晶[EtOH]
		MeO <sub>2</sub> C-N O-O-	mp,159~160℃
•			元素分析值 C <sub>17</sub> H <sub>20</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>5</sub> S <sub>2</sub>
	54		— 理論值 C,47.54;H,4.69;N,9.78
			実験値 C,47.25;H,4.53;N,9.70
•			比旋光度 [α] <sub>D</sub> <sup>20</sup> -32.8° (c=0.1,DMSO)
			無色無晶形固体
•			NMR(DMSO-d <sub>e</sub> ) δ ppm:1.48-1.70(2H,m),1.82
			-1.95(2H,m),2.55(3H,s),2.59(2H,t,J=6.5Hz)
			.3.23(3H,s),3.22-3.39(2H,m),3.56(2H,t,J=6.
		9	5Hz),3.65-3.85(2H,m),3.82(1H,dd,J=9,6Hz)
)	55	Me0~~10~0~	,3.98(2H,t,J=5Hz),4.14(1H,t,J=9Hz),4.50-4
		<b>F</b>	.56(1H,m),4.91-4.98(1H,m),7.20(1H,dd,J=9
			,2.5Hz),7.26(1H,t,J=9Hz),7.53(1H,dd,J=13.
			5,2.5Hz),10.16(1H,br-s)
	)		IR v (liq.) cm <sup>-1</sup> :1628,1754,3224
			比旋光度 [α] <sub>p</sub> <sup>20</sup> -27.1° (c=0.1,DMSO)

[0156]

【表79】

実施例	Α	物性[再結晶溶媒]
		無色結晶[DMF-CH₃CN]
• .	· /2	mp,184∼186°C
1.0		元素分析值 C₂₀H₂₀FN₃O₂S₂
56	~~ }=/	理論值 C,57.53;H,4.83;N,10.06
		実験值 C,57.28;H,4.80;N,9.96
		比旋光度 [α] <sub>0</sub> 20-20.1° (c=0.1,DMSO)

【0157】以下、本発明のジチオカルバミド酸誘導体の優れた効果を確認するために、細菌及び真菌に対する抗菌試験を行った。細菌に対する抗菌試験結果を表80に、真菌に対する抗菌試験結果を表81に示す。尚、対照化合物AとしてLinezolid [Journal of Medicinal Ch

emistry, 39巻, 673頁 (1996年) に記載の化合物] を、対照化合物Bとしてフルコナゾール [ザ・メルク・インデックス (The Merck Index), 12版, 4158に記載の化合物] を用いた。
【化9】

対照化合物A ( Linezolid)

対照化合物B

【0158】1.細菌に対する抗菌スペクトル 抗菌力 (最小発育阻止濃度)の測定は、日本化学療法学 会標準法 [日本化学療法学会誌,29巻,76頁(19 81年)]に準じて、標準菌及び感染症患者から分離された菌株 (臨床分離株,非定型抗酸菌を含む)を用い、

生菌数を10°個/mlとして行った。結果を表80に示す。本発明化合物は、対照化合物Aに比べて標準菌では同程度の抗菌活性を示し、又、臨床分離菌株に対してより優れた抗菌活性を示した。尚、表中の菌名は以下の通りである。

標準菌

Staphylococcus aureus (S. aureus)

Bacillus subtilis (B.subtilis)

臨床分離株

Methicillin - resistant Staphylococcus aureus (MRSA)

Staphylococcus epidermidis (S.epidermidis)

Enterococcus faecalis (E.faecalis) Enterococcus faecium (E.faecium)

非定型抗酸菌

Mycobacterium avium (M.avium)

Mycobacterium intracellulare (M. intracellulare)

[0159]

【表80】

標準菌に対する抗菌スペクトル(最小発育阻止濃度μg/al)						
化合物 实施例 2 対照化合物 4						
試験菌		AMICHINA				
S.aureus FDA 209P JC-1	1.56	1.56 1.56				
S.aureus Terajima	0.78	1.56				
S.aureus MS353	0.78	1.56				
B. subtilis ATCC 6633 HPR022	0.78	0.78				
臨床分離株に対する抗菌スペクトル(	最小発育阻止濃度,	ug/al)				
· 化合物 試験菌	実施例 2	対照化合物 A				
HRSA HPC 1336	0.78	1.56				
MRSA HPC 428	428 0.78					
S.epidermidis HPC 1716	0.78	1.56				
E.faecalis HPC 948	1.56-	1.56				
E.faecalis HPC 975	1.56	1.56				
非定型抗酸菌に対する抗菌スペクトル(最小発育阻止濃度μg/nl)						
化合物試験菌	実施例 2	対照化合物 A				
M. avium 20092	1.56	25				
M. avium 20096 1.56 50						
M.intracellulare 20067	12.5					

【0160】2.真菌に対する抗菌スペクトル 抗菌力(80%発育阻止濃度)の測定は、日本医真菌学 会標準委員会報告[日本医真菌学会誌,36巻,61頁 (1995年)]の方法に準じて、臨床分離株を用い、 生菌数を1-0°個/回として行った。結果を表81に示す。本発明化合物は、対照化合物A及び対照化合物Bに比べて臨床分離菌株に対して非常に優れた抗菌活性を示した。尚、表中の菌名は以下の通りである。

臨床分離株

Aspergillus fumigatus (A. fumigatus)

Candida albicans (C. albican

s)

[0161]

#### 【表81】

真菌に対する抗菌スペクトル(80%発育阻止濃度μg/al)						
化合物 実施例 実施例 実施例 実施例 対 照 対 照					対照	
試験菌	17	18	19	27	化合物A	化合物 B
A. funigatus Tsukuba	8	16.	8	- 8	>128	>128
C.albicans HY036	8	8	16	8	>128	64
C.albicans HY038	4	4	4	8	>128	16

## [0162]

【発明の効果】本発明に係るジチオカルバミド酸誘導体 又はその塩は、標準菌のみならず多剤耐性菌や非定型抗 酸菌を含めた各種の細菌及び真菌に対して優れた抗菌作用を有し、抗菌剤又は抗真菌剤として極めて有用である

## フロントページの続き

(51) Int. Cl. 6		識別記号	FΙ			
A 6 1 K	31/42	602	A 6 1 K	31/42	•	602
	31/44	609		31/44	~	609
		613				613
	31/445	614		31/445		614
	31/495	601		31/495		601
	31/535	606	•	31/535		606

特開平11-322729

( 9 0 )

CO7M 7:00

31/54 4 6 0 1 4 4 6 1

31/54

601

# This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

# **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:		
☐ BLACK BORDERS		
☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES		
☐ FADED TEXT OR DRAWING		
☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING		
☐ SKEWED/SLANTED IMAGES		
☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS		
☐ GRAY SCALE DOCUMENTS		
☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT		
☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY		
·		

# IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

☐ OTHER: \_\_\_

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK (USPTO)